

参考例 11 で得られた化合物 (R) - 44 (0.90 g, 2 mmol) の  $\text{CH}_3\text{CN}$  (10 mL) 溶液に、臭素 (0.51 mL, 10 mmol) を  $0^\circ\text{C}$  にて滴下した。3 時間攪拌した後、反応混合物を飽和  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、減  
 5 圧濃縮した。化合物 (R) - 45 ((R) - 3, 3' - ジブロモ - 4, 5, 6, 4', 5', 6' - ヘキサメトキシジフェン酸ジメチル) (1.21 g, 2 mmol) を定量的収率で得た。得られた化合物 (R) - 45 の NMR スペクトルを表 16 に示す。

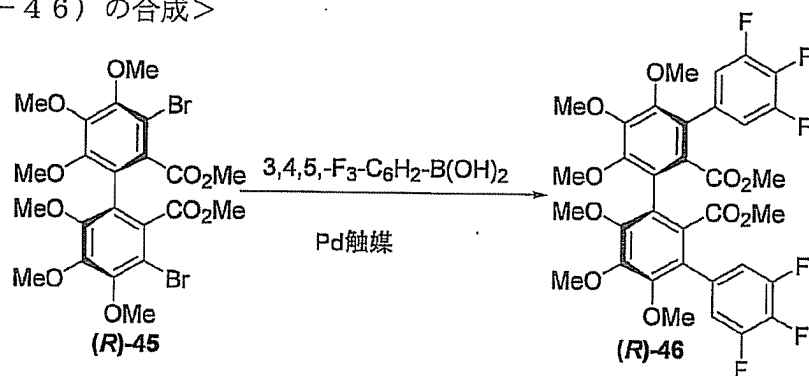
表 16

10

化合物(R)-45のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 3.95 (12H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.79 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.65 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ).	

<参考例 13 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 (R) - 46) の合成>

15



20

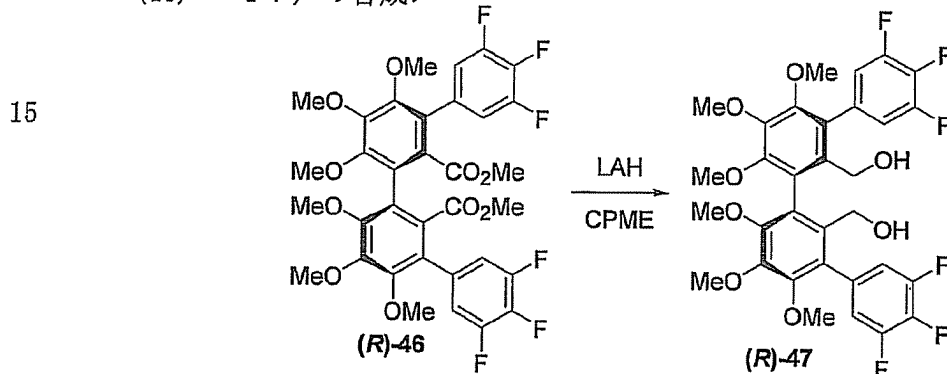
参考例 12 で得られた化合物 (R) - 45 (1.21 g, 2 mmol)、  
 3, 4, 5 - トリフルオロフェニルボロン酸 (1.06 g, 6 mmol)、  
 酢酸パラジウム (90 mg, 0.4 mmol)、トリ - *o* - トリルホスフィ  
 ン (0.49 g, 1.6 mmol)、ナトリウムメトキシド (0.32 g,  
 25 6 mmol) および DME (10 mL) の混合物を、アルゴン雰囲気下  $85^\circ\text{C}$  で加熱しながら攪拌した。出発物質の消失を TLC で確認した後、懸濁

液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液として、ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）で精製して、標題の化合物（R）－46（（R）－3, 3'－ビス（3, 4, 5－トリフルオロフェニル）－4, 5, 6, 4', 5', 6'－ヘキサメトキシジフェン酸ジメチル）（1. 14 g, 1. 60 mmol／収率：80％）を得た。得られた化合物（R）－46のNMRスペクトルを表17に示す。

表17

化合物(R)－46のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$	6.92 (4H, m, Ar-H), 3.98 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.85 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.71 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.27 (6H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ).

<参考例14：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物（R）－47）の合成>



20 参考例13で得られた化合物（R）－46（1. 10 g, 1. 55 mmol）のシクロペンチルメチルエーテル（CPME）（11 mL）溶液に、 $\text{LiAlH}_4$ （0. 29 g, 4. 64 mmol）を $-10^\circ\text{C}$ にて添加した。反応混合物を $0^\circ\text{C}$ で4時間攪拌した後、1 Nの冷HClで注意深くクエンチした。混合物を酢酸エチルで抽出し、減圧濃縮した。標題の化合物（R）－47（（R）－3, 3'－ビス（3, 4, 5－トリフルオロフェニル）－4, 5, 6, 4', 5', 6'－ヘキサメトキシジフェニル－2, 2'－ジメタ

25

ノール) (1.02 g, 1.55 mmol) を定量的収率で得た。得られた化合物 (R) - 47 の NMR スペクトルを表 18 に示す。

表 18

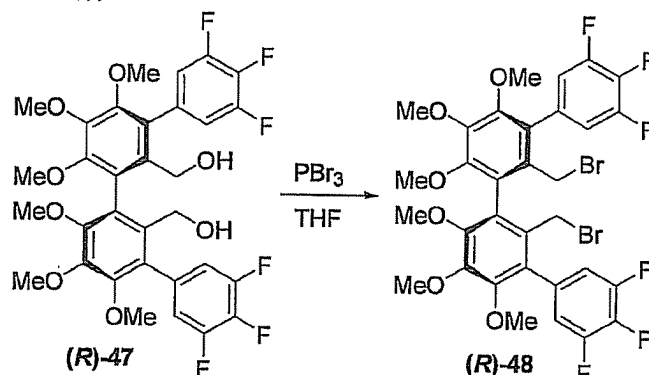
5

化合物 (R) - 47 の NMR スペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )	$\delta$ 7.09 (4H, m, Ar-H), 3.92-4.02 (10H, m, $\text{OCH}_3$ , $\text{ArCH}_2$ ), 3.76 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.71 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.19 (2H, s, OH).

<参考例 15 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 (R) - 48) の合成>

10

15



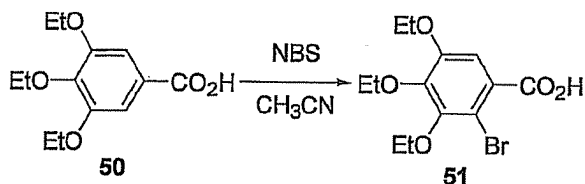
参考例 14 で得られた化合物 (R) - 47 (1.02 g, 1.55 mmol) の CPME (10 mL) 溶液に、三臭化リン (0.44 mL, 4.65 mmol) を 0℃ にて添加した。反応混合物を 0℃ で 2 時間攪拌した後、これに飽和  $\text{NaHCO}_3$  溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の化合物 (R) - 48 ((R) - 3, 3' - ビス (3, 4, 5, -トリフルオロフェニル) - 4, 5, 6, 4', 5', 6' - ヘキサメトキシビフェニル - 2, 2' - ジメチルブロミド) (1.21 g, 1.55 mmol) を定量的収率で得た。得られた化合物 (R) - 48 の NMR スペクトルを表 19 に示す。

25

表 19

化合物(R)-48のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.08 (2H, s, Ar-H), 7.00 (2H, s, Ar-H), 3.95 (10H, m, $\text{OCH}_3$ , $\text{ArCH}_2$ ), 3.87 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.73 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ).

- 5 <参考例 16 : 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 51) の合成>

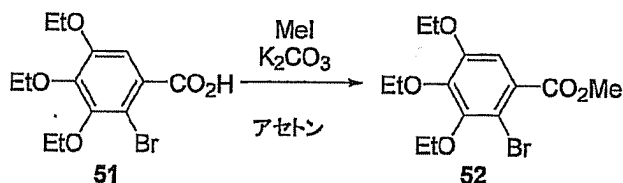


- 10 3, 4, 5-トリエトキシ安息香酸 (化合物 50) (25.43 g, 100 mmol) の  $\text{CH}_3\text{CN}$  (200 mL) 溶液に、N-ブロモスクシンイミド (NBS) (28.48 g, 160 mmol) を  $0^\circ\text{C}$  にて添加した。この溶液を  $0^\circ\text{C}$  で 3 時間攪拌した後、飽和  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  溶液を添加した。酢酸エチルで抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させて、
- 15 減圧濃縮した。標題の化合物 51 (2-ブロモ-3, 4, 5-トリエトキシ安息香酸) と副生物のスクシンイミドとの混合物を得た (47.19 g)。
- 別途精製した化合物 51 の NMR スペクトルを表 20 に示す。

表 20

化合物51のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.35 (1H, s, Ar-H), 4.17 (2H, q, $J = 7.0$ Hz, $\text{OCH}_2$ ), 4.11 (4H, q, $J = 7.0$ Hz, $\text{OCH}_2$ ), 1.46 (6H, m, $\text{CH}_3$ ), 1.39 (3H, t, $J = 7.0$ Hz, $\text{CH}_3$ ).

- 20 <参考例 17 : 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 52) の合成>

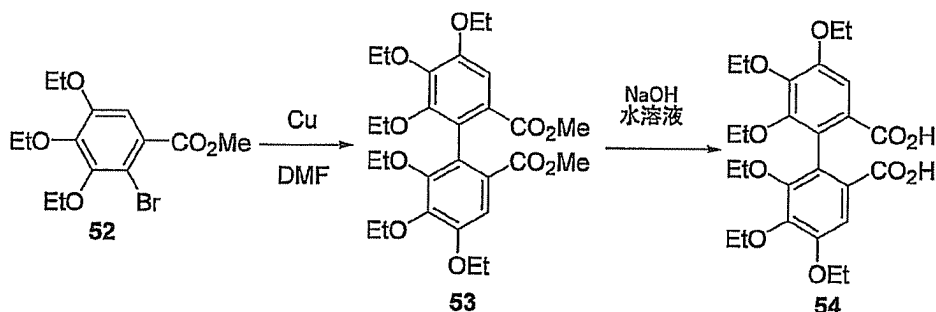


参考例 16 で得られた化合物 51 と副生物のスクシンイミドとの混合物 (47.19 g, 100 mmol) のアセトン (240 mL) 溶液に、炭酸カリウム (20.73 g, 150 mmol) およびヨウ化メチル (28.39 g, 200 mmol) を添加した。この反応混合物を還流下にて 5 時間加熱した後、反応混合物に飽和  $\text{NaHCO}_3$  溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、濃縮した。標題の化合物 52 (2-ブロモ-3,4,5-トリエトキシ安息香酸メチル) (34.86 g, 100 mmol) を定量的収率で得た。得られた化合物 52 の NMR スペクトルを表 21 に示す。

表 21

化合物 52 の NMR スペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$	7.26 (1H, s, Ar-H), 4.16-4.05 (6H, m, $\text{OCH}_2$ ), 3.92 (3H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ), 1.44 (6H, m, $\text{CH}_3$ ), 1.38 (3H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ).

<参考例 18 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 54) の合成>



参考例 17 で得られた化合物 52 (34.86 g, 100 mmol) の DMF (300 mL) 溶液に、アルゴン雰囲気下、活性 Cu 粉末 (25.42 g, 400 mmol) を添加した。脱気した後、加熱下温和に還流させた。5 時間加熱還流した後、反応混合物を濾過し、1 N の  $\text{HCl}$  溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させ

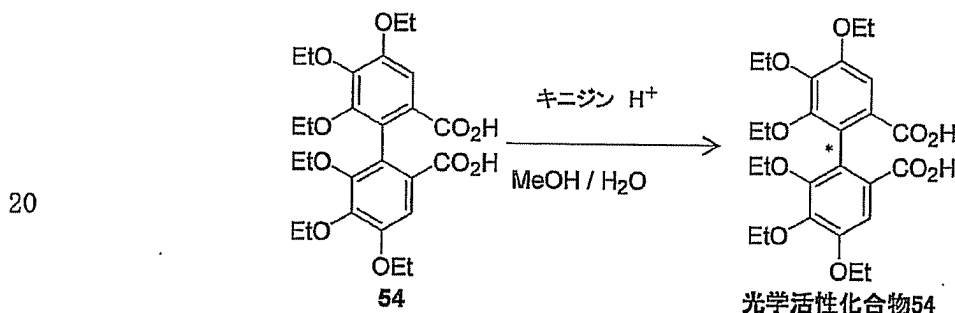
て、減圧濃縮した。カップリング生成物（化合物 53）と脱臭素化した副生成物との混合物を得た。これを、さらなる精製を行わずに、次の工程にそのまま使用した。

5 上で得た化合物 5 3 のメタノール (125 ml) 溶液に 8 N の KOH 水溶液 (37.5 ml) を滴下した。反応混合物を 5 時間還流した後、減圧下にてメタノールを除去した。残渣にメタノール (20 ml) および水 (100 ml) を加えた後、濃塩酸を加え酸性にした。析出した結晶を濾取し、水で洗淨し、乾燥させた。標題の化合物 5 4 (4, 5, 6, 4', 5', 6' - ヘキサエトキシジフェン酸) を得た。 (37.35 g, 37.35 mmol / 収率: 75%)。得られた化合物 5 4 の NMR スペクトルを表 2 2 に示す。

表 2 2

化合物54のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.36 (2H, s, Ar-H), 4.20–4.07 (12H, m, $\text{OCH}_2$ ), 1.48–1.37 (18H, m, $\text{CH}_3$ ).

15      ＜参考例 19：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化  
化合物 54）の合成＞

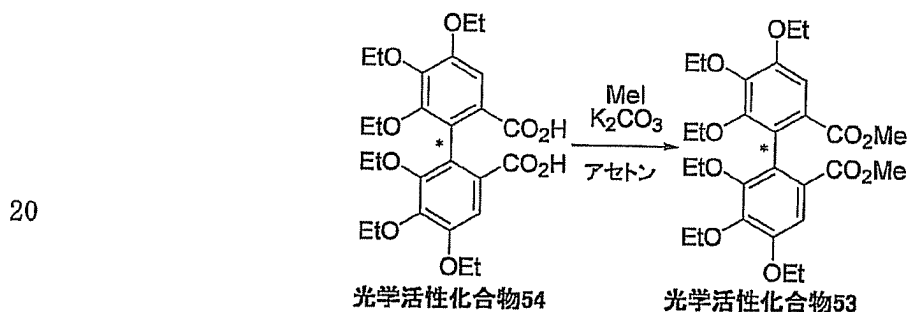


参考例 18 で得られた化合物 54 (14.39 g, 28.4 mmol) の 60% 含水メタノール (270 ml) 溶液にキニジン (18.43 g, 56.8 mmol) を添加した。反応混合物を 1 時間還流した後、ゆっくりと 0℃ まで冷却した。析出した結晶を濾取し、60% 含水メタノールで洗浄し、乾

5 乾燥させて、4, 5, 6, 4', 5', 6' -ヘキサエトキシジフェン酸ビス  
 キニジン塩を得た (9.64 g)。これを60%含水メタノール (100 m  
 1) で再結晶し、結晶を濾取し、60%含水メタノールで洗浄し、乾燥させ  
 て、4, 5, 6, 4', 5', 6' -ヘキサエトキシジフェン酸ビスキニジ  
 ン塩を得た (5.20 g)。これに酢酸エチル (30 ml) および1NのH  
 Cl水溶液 (50 ml) を加え、室温で1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出  
 し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥し、濃縮して、標題の光学活性化合物54 (光学活性  
 4, 5, 6, 4', 5', 6' -ヘキサエトキシジフェン酸) (2.40 g,  
 4.74 mmol / 収率: 17%) を得た。

10 鏡像体過剰率をHPLC分析により測定した (Daicel Chira  
 lcel AD-H, ヘキサン/2-プロパノール/TFA=97:3:0.  
 1, 流速=0.4 mL/分, 保持時間: 53.7分 (メジャー), 57.3  
 分 (マイナー))。光学活性化合物54の光学純度は99% eeであった。

15 <参考例20: 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化  
 合物53) の合成>



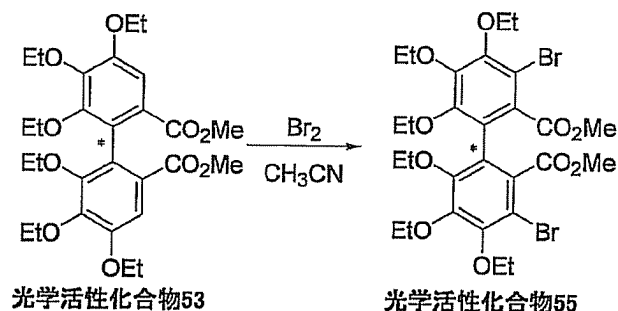
25 参考例19で得られた光学活性化合物54 (2.40 g, 4.74 mmol)  
 のアセトン (24 mL) 溶液に、炭酸カリウム (2.62 g, 19 mmol)  
 およびヨウ化メチル (4.04 g, 28.4 mmol) を添加した。  
 この反応混合物を還流下にて5時間加熱した後、反応混合物に飽和NaHCO

O<sub>3</sub>溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層をNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥して、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物53（光学活性4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサエトキシジフェン酸ジメチル）（1.55g, 2.90 mmol / 収率：61%）を得た。得られた光学活性化合物53のNMRスペクトルを表23に示す。

表 2 3

光学活性化合物53のNMRスペクトル
400 MHz <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 7.32 (2H, s, Ar-H), 4.17-4.11 (12H, m, OCH <sub>2</sub> ), 3.56 (6H, s, CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ), 1.48 (6H, t, J = 7.0 Hz, CH <sub>3</sub> ), 1.37 (6H, t, J = 7.1 Hz, CH <sub>3</sub> ), 0.97 (6H, t, J = 7.0 Hz, CH <sub>3</sub> ).

<参考例 21：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化合物55）の合成>



参考例 20 で得られた光学活性化合物53（1.55g, 2.90 mmol）のCH<sub>3</sub>CN（15 mL）溶液に、臭素（0.71 mL, 14 mmol）を0℃にて滴下した。3時間攪拌した後、反応混合物を飽和Na<sub>2</sub>SO<sub>3</sub>水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、減圧濃縮した。標題の化合物55（光学活性3, 3'-ジブromo-4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサエトキシジフェン酸ジメチル）（2.05g, 2.90 mmol）を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物55のNMRスペクトルを表24に示す。

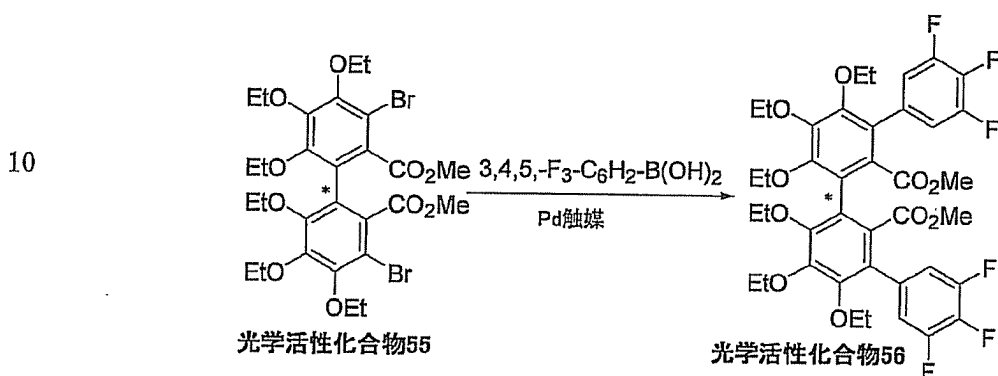


表 2 4

光学活性化合物55のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$	4.20–4.05 (12H, m, $\text{OCH}_2$ ), 3.63 (6H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ), 1.45 (6H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ), 1.38 (6H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ), 1.05 (6H, t, $J = 7.0$ Hz, $\text{CH}_3$ ).

5

<参考例 2 2 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 5 6) の合成>



参考例 2 1 で得られた光学活性化合物 5 5 (2.05 g, 2.90 mmol)、3, 4, 5-トリフルオロフェニルボロン酸 (1.53 g, 8.7 mmol)、酢酸パラジウム (0.13 g, 0.58 mmol)、トリ-*o*-トリルホスフィン (0.71 g, 2.32 mmol)、ナトリウムメトキシド (0.47 g, 8.7 mmol) および DME (17 mL) の混合物を、アルゴン雰囲気下 85℃ で加熱しながら攪拌した。出発物質の消失を TLC で確認した後、懸濁液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、ヘキサン/酢酸エチル=5/1) で精製して、標題の光学活性化合物 5 6 (光学活性 3, 3'-ビス (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) -4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサエトキシジフェン酸ジメチル) (1.83 g, 2.26 mmol / 収率: 78%) を得た。得られた光学活性化合物 5 6 の NMR スペクトルを表 2 5 に示す。

15

20

25

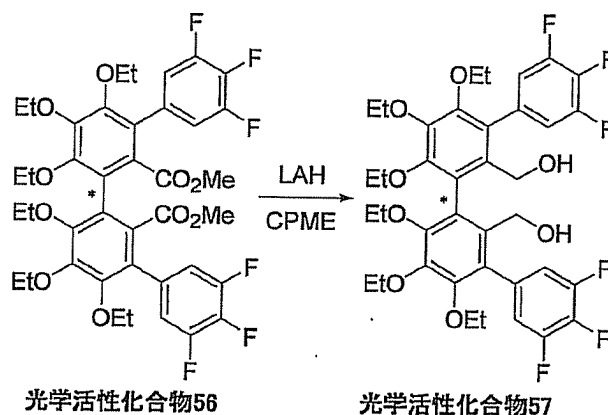
表 2 5

光学活性化合物56のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):	$\delta$ 6.89 (4H, m, Ar-H), 4.27-3.89 (12H, m, $\text{OCH}_2$ ), 3.25 (6H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ), 1.41 (6H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ), 1.11 (12H, m, $\text{CH}_3$ ).

5

<参考例 2 3 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 5 7) の合成>

10



15

参考例 2 2 で得られた光学活性化合物 5 6 (1.83 g, 2.26 mmol) の CPME (18 mL) 溶液に、 $\text{LiAlH}_4$  (0.43 g, 11.3 mmol) を  $-10^\circ\text{C}$  にて添加した。反応混合物を  $0^\circ\text{C}$  で 4 時間攪拌した後、1 N の冷 HCl で注意深くクエンチした。反応混合物に酢酸エチルを加えて抽出し、有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 5 7 (光学活性 3, 3' -ビス (3, 4, 5 -トリフルオロフェニル) -4, 5, 6, 4', 5', 6' -ヘキサエトキシビフェニル-2, 2' -ジメタノール) (1.72 g, 2.26 mmol) を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物 5 7 の NMR スペクトルを表 2 6 に示す。

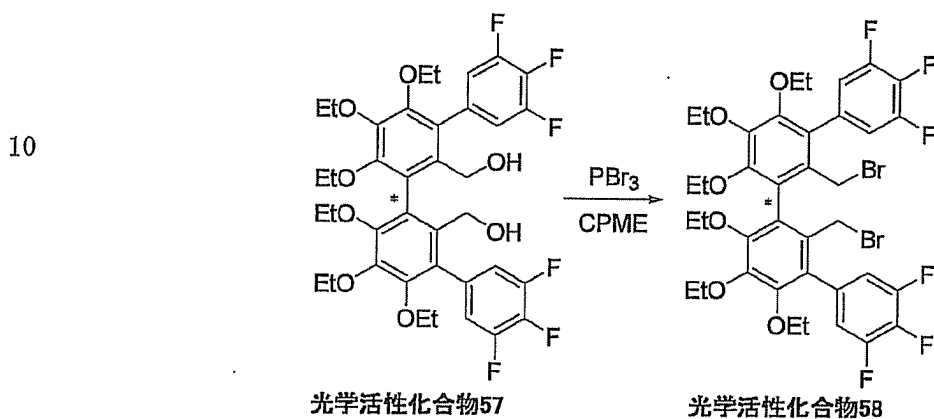
25

表 2 6

光学活性化合物57のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.12 (4H, m, Ar-H), 4.17–3.73 (16H, m, $\text{OCH}_2$ , $\text{ArCH}_2$ ), 3.28 (2H, s, OH), 1.40 (6H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ), 1.10 (12H, m, $\text{CH}_3$ ).

5

<参考例 2 4 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 5 8) の合成>



15

参考例 2 3 で得られた光学活性化合物 5 7 (1. 7 2 g, 2. 2 6 mmol) の CPME (1 8 mL) 溶液に、三臭化リン (0. 6 4 mL, 7. 8 mmol) を 0℃ にて添加した。反応混合物を 0℃ で 2 時間攪拌した後、これに飽和  $\text{NaHCO}_3$  溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 5 8 (光学活性 3, 3'-ビス (3, 4, 5, -トリフルオロフェニル) -4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサエトキシビフェニル-2, 2'-ジメチルプロミド) (1. 9 5 g, 2. 2 6 mmol) を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物 5 8 の NMR スペクトルを表 2 7 に示す。

20

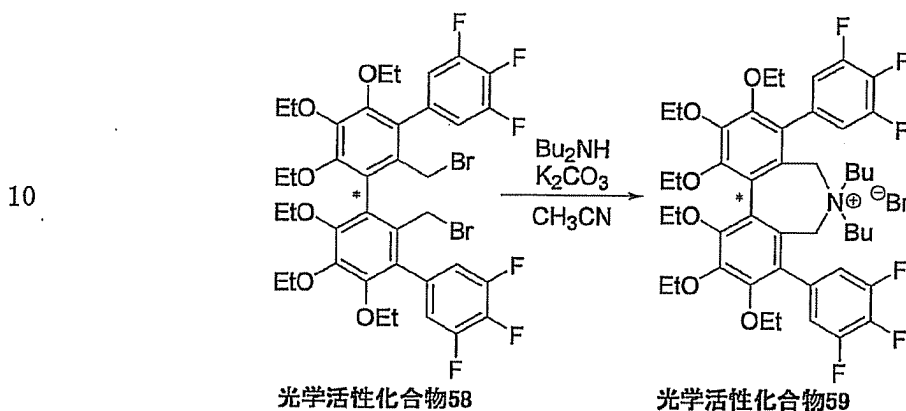
25

表 2 7

光学活性化合物58のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.02 (4H, m, Ar-H), 4.18–3.91 (16H, m, $\text{OCH}_2$ , $\text{ArCH}_2\text{Br}$ ), 1.40 (6H, t, $J = 7.1$ Hz, $\text{CH}_3$ ), 1.10 (12H, m, $\text{CH}_3$ ).

5

<実施例 15：4 級アンモニウム塩（光学活性化合物 59）の合成>



15 参考例 24 で得られた光学活性化合物 58 (1.95 g, 2.26 mmol) と炭酸カリウム (0.375 g, 7.1 mmol) とのアセトニトリル懸濁液 (15 mL) に、窒素雰囲気下にてジブチルアミン (0.424 mL, 2.49 mmol) を添加した。この反応混合物を 80 °C で 3 時間加熱した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、メタノール/トルエン=1/5) で精製して、標題の光学活性な 4 級アンモニウムブロミド (光学活性化合物 59) を得た (1.32 g, 1.45 mmol / 収率: 64%)。得られた光学活性化合物 59 の NMR スペクトルを表 28 に示す。

25

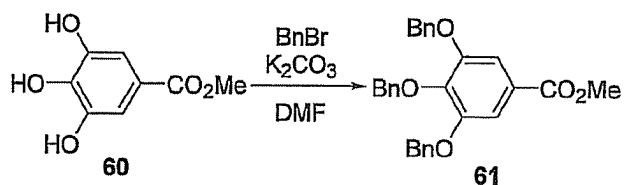
表 2 8

## 実施例 15 で得られた光学活性化合物 59 の NMR スペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.26 (2H, m, Ar-H), 7.00 (2H, m, Ar-H), 4.36 (4H, m,  $\text{OCH}_2$ ), 4.16–4.04 (8H, m,  $\text{OCH}_2$ ), 3.95 (2H, d,  $J = 12.8$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 3.76 (2H, d,  $J = 12.8$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 3.04 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 2.77 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 1.45 (6H, t,  $J = 7.0$  Hz,  $\text{CH}_3$ ), 1.18–1.07 (18H, m,  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3$ ), 0.76 (6H, m,  $\text{CH}_3$ ), 0.23 (2H, m,  $\text{CH}_2$ ).

<参考例 2 5 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 6

1) の合成>



3, 4, 5-トリヒドロキシ安息香酸メチル (化合物 6 0) (18.41 g, 100 mmol) の DMF (70 mL) 溶液に、炭酸カリウム (63.31 g, 400 mmol) およびベンジルブロミド (59.47 mL, 500 mmol) を添加した。この反応混合物を 120℃ で 7 時間攪拌した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、減圧濃縮した。標題の化合物 6 1 (3, 4, 5-トリベンジロキシ安息香酸メチル) (47.19 g) を定量的収率で得た。化合物 6 1 の NMR スペクトルを表 2 9 に示す。

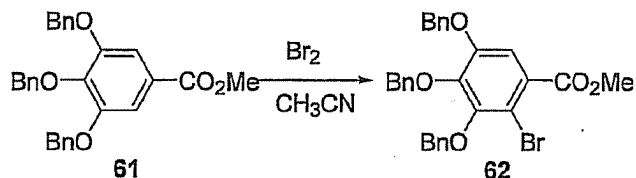
表 2 9

## 化合物 61 の NMR スペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.45–7.24 (17H, m, Ar-H), 5.14 (4H, s,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 5.11 (2H, s,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.89 (3H, s,  $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ).

<参考例 2 6 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 6

2) の合成>

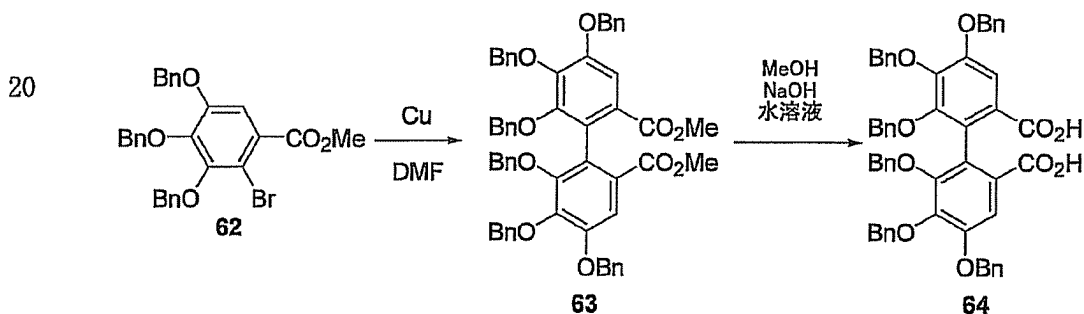


5      参考例 25 で得られた化合物 61 (47.19 g, 100 mmol) の  $\text{CH}_3\text{CN}$  (300 mL) 溶液に、臭素 (20.5 mL, 400 mmol) を  $-10^\circ\text{C}$  にて滴下した。この溶液を  $0^\circ\text{C}$  で 5 時間攪拌した後、飽和  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  溶液を添加した。酢酸エチルで抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させて、減圧濃縮した。標題の化合物 62 (2-ブ  
10      モー 3, 4, 5-トリベンジロキシ安息香酸メチル) (53.5 g, 100 mmol) を定量的収率で得た。化合物 62 の NMR スペクトルを表 30 に示す。

表 30

化合物 62 の NMR スペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.45–7.24 (16H, m, Ar-H), 5.05 (6H, m, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.99 (3H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ).

<参考例 27 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 64) の合成>



25      参考例 26 で得られた化合物 62 (53.5 g, 100 mmol) の DMF (300 mL) 溶液に、アルゴン雰囲気下、活性 Cu 粉末 (12.71 g,

5

10

表 3 1

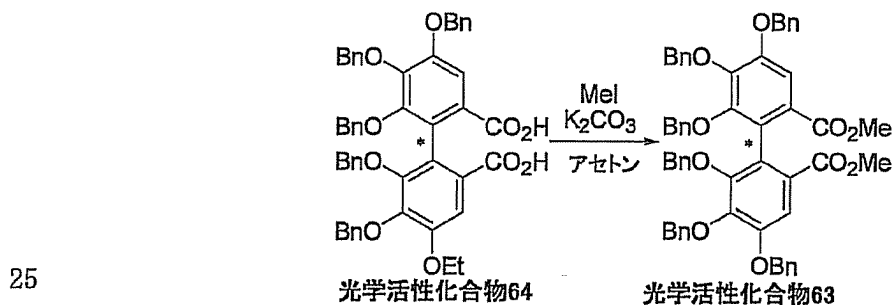
化合物64のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.63 (2H, s, Ar-H), 7.49 (4H, d, $J = 6.9$ Hz, Ar-H), 7.41–7.22 (18H, m, Ar-H), 7.05 (6H, m, Ar-H), 6.81 (2H, d, $J = 6.4$ Hz, Ar-H), 5.25 (2H, d, $J = 11.4$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 5.15 (2H, d, $J = 11.3$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.98–4.93 (6H, m, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.74 (2H, d, $J = 11.2$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ).

20



鏡像体過剰率をHPLC分析により測定した (Daicel Chiral  
15 cell AD-H, ヘキサン/2-プロパノール/TFA=93:7:0.1, 流速=0.6 mL/分, 保持時間: 35.1分 (メジャー), 54.4分 (マイナー))。光学活性化合物64の光学純度は99% eeであった。

20      <参考例 29：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化  
化合物 63）の合成>



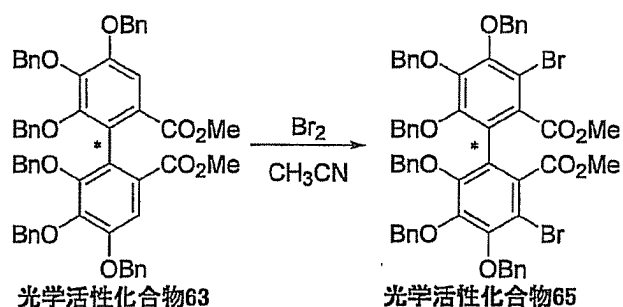


参考例 28 で得られた光学活性化合物 64 (2.40 g, 4.74 mmol) のアセトン (24 mL) 溶液に、炭酸カリウム (2.62 g, 19 mmol) およびヨウ化メチル (4.04 g, 28.4 mmol) を添加した。この反応混合物を還流下にて 5 時間加熱した後、反応混合物に飽和 NaHCO<sub>3</sub> 溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥して、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 63 (光学活性 4, 5, 6, 4', 5', 6' -ヘキサベンジロキシジフェン酸ジメチル) (1.55 g, 2.90 mmol / 61% 収率) を得た。得られた光学活性化合物 63 の NMR スペクトルを表 32 に示す。

表 3 2

光学活性化合物63のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.54 (2H, s, Ar-H), 7.50 (4H, d, $J$ = 6.7 Hz, Ar-H), 7.41–7.11 (22H, m, Ar-H) , 6.86 (4H, d, $J$ = 6.2 Hz, Ar-H) , 5.20 (4H, d, $J$ = 4.9 Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ) , 5.15 (4H, d, $J$ = 4.1 Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ) , 4.89 (2H, d, $J$ = 11.2 Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ) , 4.76 (2H, d, $J$ = 11.1 Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ) , 3.58 (6H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ).

＜参考例 30：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化  
化合物 65）の合成＞



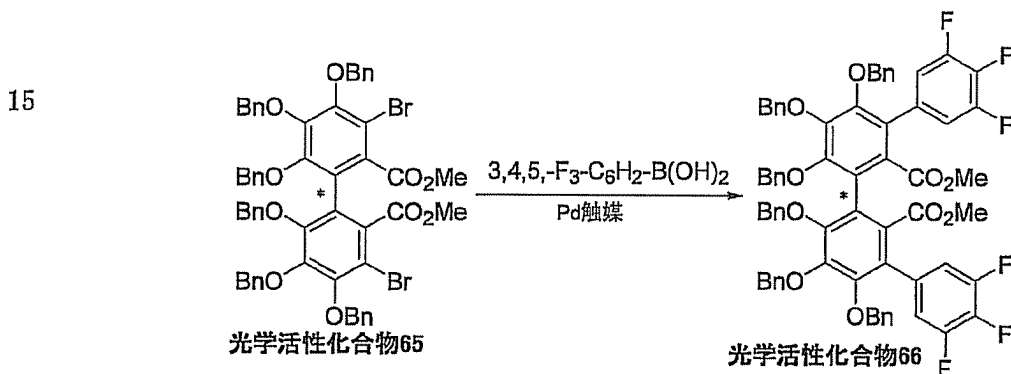
参考例 29 で得られた光学活性化合物 63 (2.06 g, 2.27 mmol) の  $\text{CH}_3\text{CN}$  (50 mL) 溶液に、臭素 (1.40 mL, 27.2 mmol) を  $-10^\circ\text{C}$  にて滴下した。 $0^\circ\text{C}$  にて 3 時間攪拌した後、反応混合物を飽和  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機層を飽和

和食塩水で洗浄し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液として、ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）で精製して、標題の光学活性化合物65（光学活性3, 3'-ジブromo-4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサベンジロキシジフェン酸ジメチル）（0.19g, 0.178mmol／収率：7.9%）を得た。得られた光学活性化合物65のNMRスペクトルを表33に示す。

表 3 3

光学活性化合物65のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.52 (4H, d, $J = 2.1$ Hz, Ar-H), 7.50-7.15 (22H, m, Ar-H), 6.94 (4H, m, Ar-H), 5.12-4.85 (12H, m, Ar-H), 3.68 (6H, s, $\text{CO}_2\text{CH}_3$ ).

<参考例31：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化合物66）の合成>



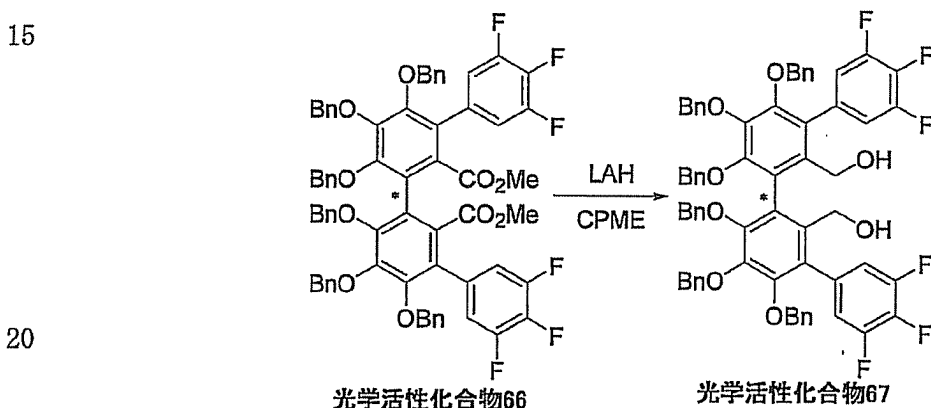
20 参考例30で得られた光学活性化合物65（0.19g, 0.178mmol）、3, 4, 5-トリフルオロフェニルボロン酸（94mg, 0.53mmol）、酢酸パラジウム（8.0mg, 0.036mmol）、トリ-  
 25 ートリルホスフィン（43mg, 0.142mmol）、ナトリウムメトキシド（29mg, 0.53mmol）およびDME（5mL）の混合物を、アルゴン雰囲気下85℃で加熱しながら攪拌した。出発物質の消失をTLCで確認した後、懸濁液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカ

ラムクロマトグラフィー（溶出液として、ヘキサン／酢酸エチル＝５／１）で精製して、標題の光学活性化合物 66（光学活性 3, 3'-ビス（3, 4, 5-トリフルオロフェニル）-4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサベンジロキシジフェン酸ジメチル）（0.15 g, 0.129 mmol／収率：72％）を得た。得られた光学活性化合物 66 の NMR スペクトルを表 34 に示す。

表 34

光学活性化合物65のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ 7.36–7.21 (22H, m, Ar-H), 7.05–6.96 (8H, m, Ar-H), 6.65 (4H, m, Ar-H), 5.21 (2H, d, $J = 11.2$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 5.10 (4H, dd, $J = 10.8$ Hz, $J = 3.4$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.96 (4H, dd, $J = 10.7$ Hz, $J = 2.5$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.84 (2H, d, $J = 10.8$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.27 (6H, s, $\text{C O}_2\text{CH}_3$ ).

<参考例 32：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化合物 67）の合成>



参考例 31 で得られた光学活性化合物 66（150 mg, 0.129 mmol）の CPME（5 mL）溶液に、 $\text{LiAlH}_4$ （36 mg, 0.9 mmol）を  $-10^\circ\text{C}$  にて添加した。反応混合物を  $0^\circ\text{C}$  で 3 時間攪拌した後、1 N の冷  $\text{HCl}$  で注意深くクエンチし、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 67（光学活性 3,

3'-ビス(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4,5,6,4',5',6'-ヘキサベンジロキシビフェニル-2,2'-ジメタノール  
(149mg, 0.129mmol) を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物67のNMRスペクトルを表35に示す。

5

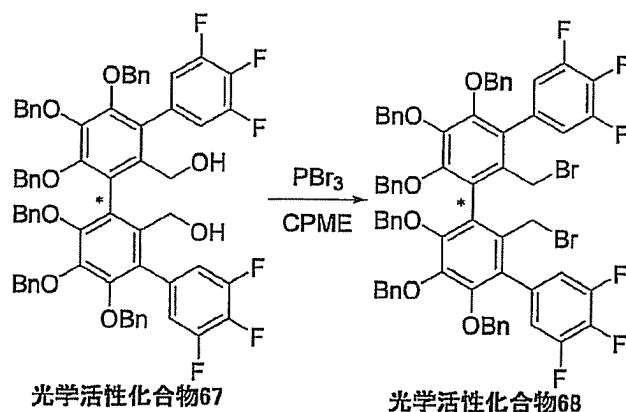
表 3 5

光学活性化合物67のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):	$\delta$ 7.37-7.24 (22H, m, Ar-H), 7.04-6.87 (10H, m, Ar-H), 6.77 (2H, m, Ar-H), 5.12-5.01 (8H, m, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.86-4.81 (4H, dd, $J = 11.0$ Hz, $J = 7.0$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.07 (2H, d, $J = 11.4$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.97 (2H, d, $J = 11.4$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ).

10

<参考例33: 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質(光学活性化合物68)の合成>

15



参考例32で得られた光学活性化合物67(100mg, 0.09mmol)のCPME(3mL)溶液に、三臭化リン(0.034mL, 0.54mmol)を0℃にて添加した。反応混合物を0℃で4時間攪拌した。次いで、これに飽和 $\text{NaHCO}_3$ 溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物68(光学活性3,3'-ビス(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4,5,6,4',5',6'-ヘキサベンジロキシビフェニル-2,2'-ジメチルプロミド)(69mg, 0.056mmol/収率: 62%)を得た。得られ

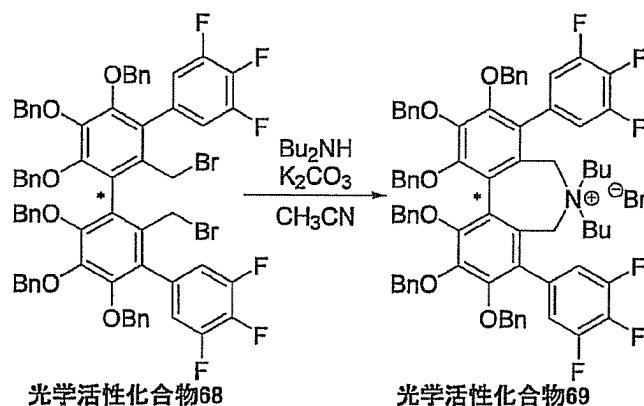
25

た光学活性化合物 68 の NMR スペクトルを表 3 6 に示す。

表 3 6

光学活性化合物68のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ):	$\delta$ 7.34–7.23 (22H, m, Ar-H), 6.98 (8H, d, $J$ = 6.5 Hz, Ar-H), 6.82–6.71 (4H, m, Ar-H), 5.18 (2H, d, $J$ = 11.9 Hz, $\text{ArCH}_2$ ), 5.07–5.00 (6H, m, $\text{ArCH}_2$ ), 4.93–4.86 (4H, m, $\text{ArCH}_2$ ), 3.96 (4H, m, $\text{ArCH}_2$ ).

<実施例 1 6 : 4 級アンモニウム塩 (光学活性化合物 6 9) の合成>



参考例 3 3 で得られた光学活性化合物 6 8 (6 9 m g , 0 . 0 5 6 m m o l ) と炭酸カリウム (1 2 m g , 0 . 0 8 4 m m o l ) とのアセトニトリル懸濁液 (3 m L ) に、窒素雰囲気下にてジブチルアミン (0 . 0 1 1 m L , 0 . 0 6 2 m m o l ) を添加した。この反応混合物を 8 0 ° C で 3 時間加熱した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、メタノール/トルエン = 1 / 5) で精製して、標題の光学活性な 4 級アンモニウムブロミド (光学活性化合物 6 9) を得た (7 1 m g , 0 . 0 5 5 m m o l / 収率 : 9 8 % ) 。本実施例で得られた光学活性化合物 6 9 の NMR スペクトルを表 3 7 に示す。

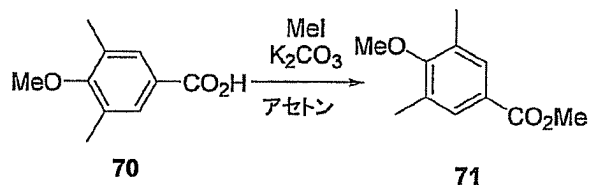
表 3 7

## 実施例16で得られた光学活性化合物69のNMRスペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.45–7.13 (28H, m, Ar-H), 6.96 (4H, m, Ar-H), 6.61 (2H, m, Ar-H), 5.34 (2H, d,  $J = 11.1$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 5.18 (4H, s,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 5.11 (2H, d,  $J = 11.2$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 4.98 (4H, dd,  $J = 4.2, 6.9$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.98 (2H, d,  $J = 13.5$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 3.60 (2H, d,  $J = 13.5$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 2.87 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 2.61 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 1.15–1.00 (6H, m,  $\text{CH}_2$ ), 0.75 (6H, t,  $J = 7.0$  Hz,  $\text{CH}_3$ ), 0.21 (2H, m,  $\text{CH}_2$ ).

<参考例 3 4 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 7

1) の合成>



3, 5-ジメチルー4-メトキシ安息香酸 (化合物 70) (2.70 g, 15 mmol) のアセトン (27 mL) 溶液に、炭酸カリウム (4.15 g, 30 mmol) およびヨウ化メチル (5.60 mL, 90 mmol) を添加した。この反応混合物を5時間還流した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、減圧濃縮した。標題の化合物 71 (3, 5-ジメチルー4-メトキシ安息香酸メチル) (2.91 g) を定量的収率で得た。化合物 71 の NMR スペクトルを表 3 8 に示す。

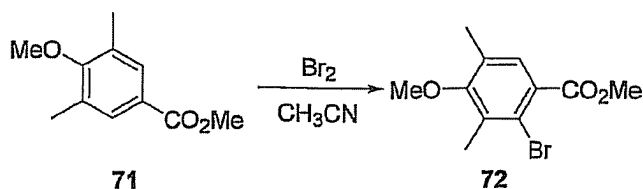
表 3 8

## 化合物61のNMRスペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.71 (2H, s, Ar-H), 3.88 (3H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 3.75 (6H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 2.31 (6H, s,  $\text{CH}_3$ ).

<参考例 3 5 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 7

2) の合成>



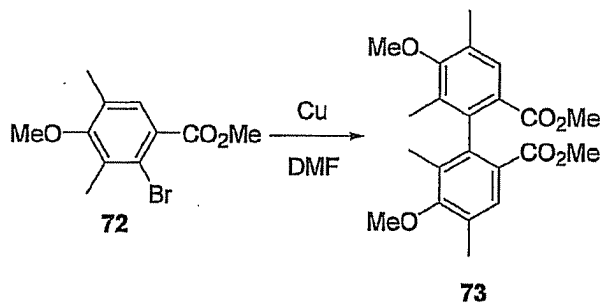
- 5      参考例 3 4 で得られた化合物 7 1 (2.91 g, 15 mmol) の  $\text{CH}_3\text{CN}$  (30 mL) 溶液に、臭素 (6.15 mL, 120 mmol) を  $-10^\circ\text{C}$  にて滴下した。この溶液を室温で 5 時間攪拌したのち、飽和  $\text{Na}_2\text{SO}_3$  溶液を添加した。酢酸エチルで抽出し、有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させて、減圧濃縮した。標題の化合物 7 2 (2-ブロモ-3, 5-ジメチル-4-メ
- 10      トキシ安息香酸メチル) (4.10 g, 15 mmol) を定量的収率で得た。化合物 7 2 の NMR スペクトルを表 3 9 に示す。

表 3 9

化合物 72 の NMR スペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )	$\delta$ 7.41 (1H, s, Ar-H), 3.91 (3H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.71 (3H, s, $\text{OCH}_3$ ), 2.40 (3H, s, $\text{CH}_3$ ), 2.26 (3H, s, $\text{CH}_3$ ).

15

<参考例 3 6 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 7 3) の合成>



20

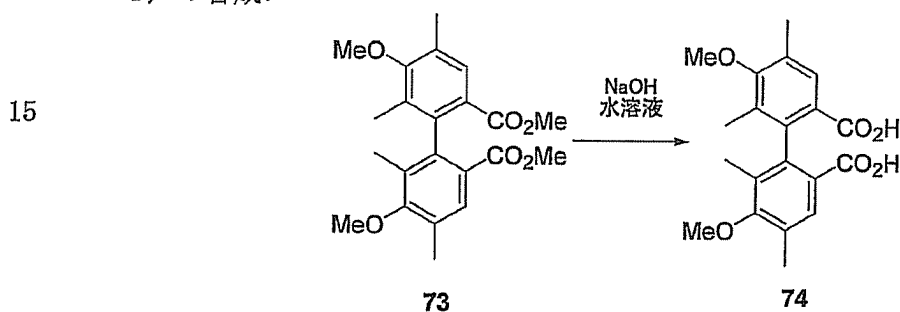
- 25      参考例 3 5 で得られた化合物 7 2 (4.10 g, 15 mmol) の DMF (25 mL) 溶液に、アルゴン雰囲気下、活性 Cu 粉末 (3.81 g, 60 mmol) を添加した。脱気した後、加熱下温和に還流させた。4 時間加熱

還流した後、反応混合物を濾過し、1 NのHCl溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥させて、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液として、ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）で精製して、標題の化合物73（4，6，4'，5，6'-テトラメチルー5，5'-ジメトキシジフェン酸ジメチル）を得た（2.27 g，5.87 mmol／収率：78%）。得られた化合物73のNMRスペクトルを表40に示す。

表 40

10	<div style="text-align: center;">化合物73のNMRスペクトル</div> <div>400 MHz <math>^1\text{H}</math> NMR (<math>\text{CDCl}_3</math>) <math>\delta</math> 7.72 (2H, s, Ar-H), 3.75 (6H, s, <math>\text{OCH}_3</math>), 3.56 (6H, s, <math>\text{OCH}_3</math>), 2.36 (6H, s, <math>\text{CH}_3</math>), 1.80 (6H, s, <math>\text{CH}_3</math>).</div>	
----	---	--

＜参考例 3 7: 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物 7 4）の合成＞



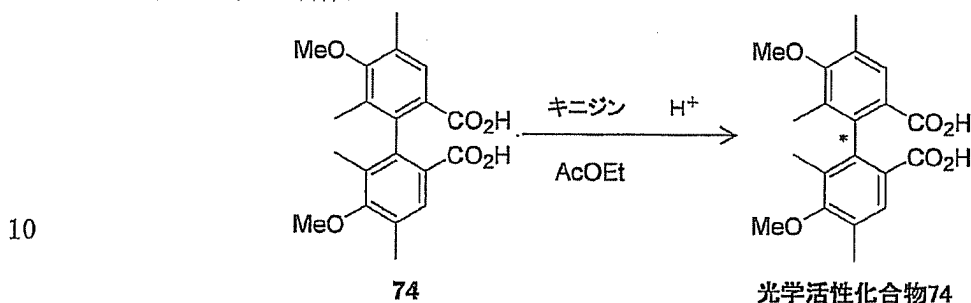
参考例 36 で得られた化合物 73 (0.43 g, 1.1 mmol) のメタノール (10 ml) 溶液に 8 N の KOH 水溶液 (4 ml) を滴下した。反応混合物を 5 時間還流した後、減圧下にてメタノールを除去した。残渣に 2 N の塩酸を加え酸性にし、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させて、減圧濃縮した。標題の化合物 74 (4, 6, 4', 6' - テトラメチルー 5, 5' - ジメトキシジフェン酸) (0.39 g, 1.1 mmol) を定量的収率で得た。得られた化合物 74 の NMR スペクトルを表 41 に示す。



表 4 1

化合物74のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.72 (2H, s, Ar-H), 3.72 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 2.36 (6H, s, $\text{CH}_3$ ), 1.75 (6H, s, $\text{CH}_3$ ).

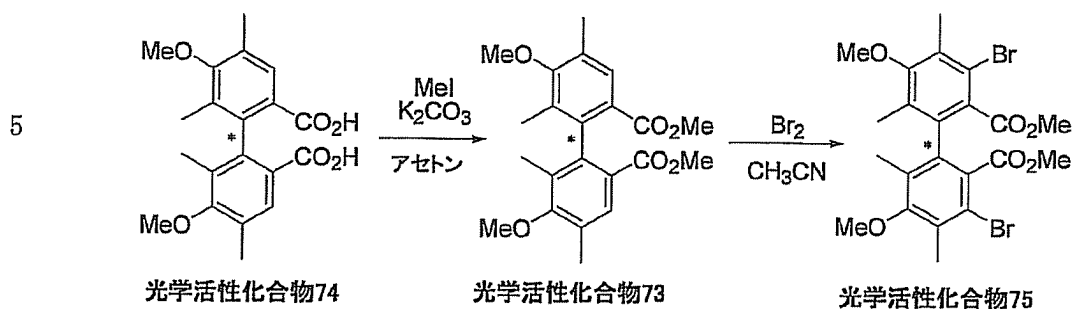
5      ＜参考例 38：4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質（光学活性化  
化合物 74）の合成＞



参考例 37 で得られた化合物 74 (0.39 g, 1.1 mmol) の酢酸エチル (4 ml) 溶液にキニジン (0.71 g, 38.7 mmol) を添加した。反応混合物を 1 時間還流した後、ゆっくりと 0℃まで冷却した。析出した結晶を濾取し、酢酸エチルで洗浄し、乾燥させて、4, 6, 4', 6'-テトラメチル-5, 5'-ジメトキシジフェン酸ビスキニジン塩を得た (0.50 g)。これに酢酸エチル (10 ml) および 1N の HCl 水溶液 (20 ml) を加え、室温で 1 時間攪拌した。酢酸エチルで抽出し、有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮して、標題の光学活性化合物 74 (光学活性 4, 6, 4', 6'-テトラメチル-5, 5'-ジメトキシジフェン酸) (0.16 g, 0.45 mmol / 収率: 41%) を得た。

鏡像体過剰率をHPLC分析により測定した (Daicel Chiralcel AD-H, ヘキサン/2-プロパノール/TFA=95:5:0.1, 流速=0.7 mL/分, 保持時間: 16.6分 (マイナー), 34.1分 (メジャー))。光学活性化合物74の光学純度は99% eeであった。

<参考例 39 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化化合物 75) の合成>



10            参考例 38 で得られた光学活性化化合物 74 (0.16 g, 0.45 mmol) のアセトン (5 mL) 溶液に、炭酸カリウム (247 mg, 1.79 mmol) およびヨウ化メチル (556  $\mu$ l, 8.92 mmol) を添加した。この反応混合物を還流下にて 5 時間加熱した後、反応混合物に飽和 NaHCO<sub>3</sub> 溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥して、  
15            減圧濃縮した。光学活性化化合物 73 (光学活性 4, 6, 4', 6' - テトラメチルー 5, 5' - ジメトキシジフェン酸ジメチル) (0.17 g, 0.45 mmol) を定量的収率で得た。

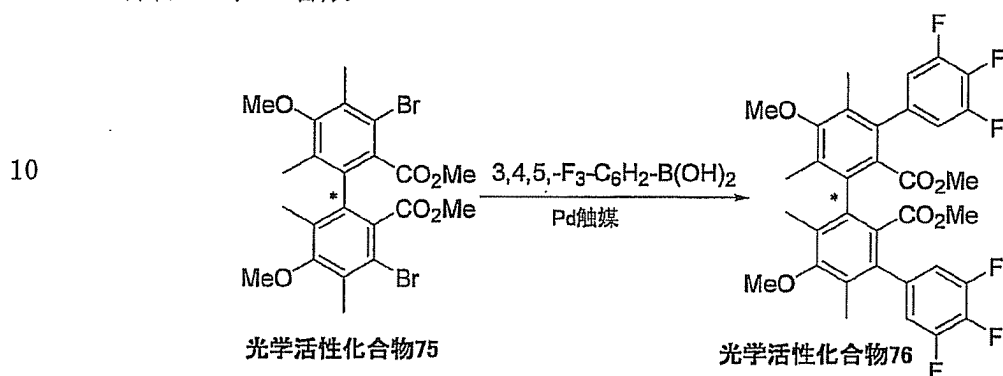
              上記のようにして得た光学活性化化合物 73 (0.17 g, 0.45 mmol) の CH<sub>3</sub>CN (5 mL) 溶液に、臭素 (458  $\mu$ l, 8.92 mmol) を 0℃ にて滴下した。室温にて 5 時間攪拌した後、反応混合物を飽和 Na<sub>2</sub>SO<sub>3</sub> 水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥して、減圧濃縮した。標題の光学活性化化合物 75 (光学活性 3, 3' - ジ  
20            ブロモー 4, 6, 4', 6' - テトラメチルー 5, 5' - ジメトキシジフェン酸ジメチル) (0.24 g, 0.45 mmol) を定量的収率で得た。得  
25            られた光学活性化化合物 75 の NMR スペクトルを表 42 に示す。

表 4 2

光学活性化合物75のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 3.71 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.59 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 2.42 (6H, s, $\text{CH}_3$ ), 1.90 (6H, s, $\text{CH}_3$ ).

5

<参考例 40 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 76) の合成>



- 15 参考例 39 で得られた光学活性化合物 75 (0.24 g, 0.45 mmol)、3, 4, 5-トリフルオロフェニルボロン酸 (236 mg, 1.34 mmol)、酢酸パラジウム (20 mg, 0.089 mmol)、トリ-*o*-トリルホスフィン (109 mg, 0.36 mmol)、ナトリウムメトキシド (72 mg, 1.34 mmol) および DME (4 mL) の混合物を、
- 20 アルゴン雰囲気下 85°C で加熱しながら攪拌した。出発物質の消失を TLC で確認した後、懸濁液を濾過した。濾液に 1 N の HCl 溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥させて、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、ヘキサン/酢酸エチル = 15/1) で精製して、標題の光学活性化合物 76
- 25 (光学活性 3, 3'-ビス (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) -4, 6, 4', 6'-テトラメチル-5, 5'-ジメトキシジフェン酸ジメチル)

(184 mg, 0.285 mmol / 収率: 64%) を得た。得られた光学活性化合物 76 の NMR スペクトルを表 4 3 に示す。

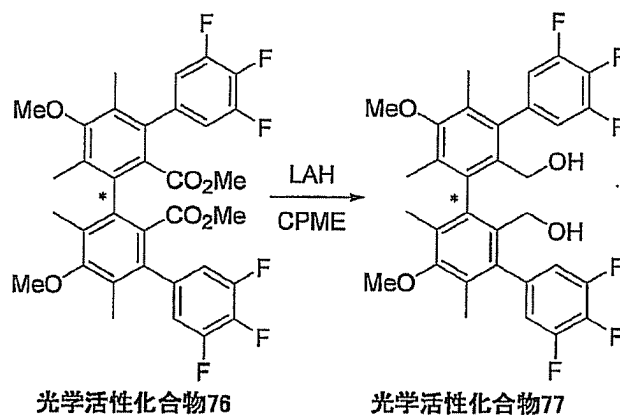
表 4 3

5

光学活性化合物76のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )	$\delta$ 6.84 (4H, m, Ar-H), 3.76 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.21 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 2.36 (6H, s, $\text{CH}_3$ ), 1.80 (6H, s, $\text{CH}_3$ ).

<参考例 4 1 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 7 7) の合成>

10



15

参考例 4 0 で得られた光学活性化合物 7 6 (184 mg, 0.285 mmol) の CPME (3 mL) 溶液に、 $\text{LiAlH}_4$  (54 mg, 1.42 mmol) を  $-10^\circ\text{C}$  にて添加した。反応混合物を  $0^\circ\text{C}$  で 3 時間攪拌した後、1 N の冷  $\text{HCl}$  で注意深くクエンチし、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 7 7 (光学活性 3, 3'-ビス (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) -4, 6, 4', 6'-テトラメチル-5, 5'-ジメトキシビフェニル-2, 2'-ジメタノール) (168 mg, 0.285 mmol) を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物 7 7 の NMR スペクトルを表 4 4 に示す。

25

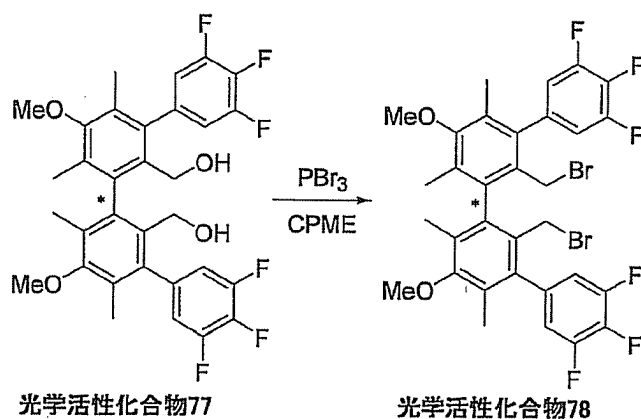
表 4 4

光学活性化合物77のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ )	$\delta$ 7.06 (2H, m, Ar-H), 6.82 (2H, m, Ar-H), 3.93 (4H, s, $\text{ArCH}_2\text{O}$ ), 3.73 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.27 (2H, s, OH), 2.02 (6H, s, $\text{CH}_3$ ), 1.83 (6H, s, $\text{CH}_3$ ).

5

<参考例 4 2 : 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (光学活性化合物 7 8) の合成>

10



15

参考例 4 1 で得られた光学活性化合物 7 7 (1 6 8 m g , 0 . 2 8 5 m m o l ) の C P M E ( 3 m L ) 溶液に、三臭化リン ( 0 . 1 3 4 m L , 1 . 4 2 m m o l ) を 0 ° C にて添加した。反応混合物を 0 ° C で 4 時間攪拌した。次いで、これに飽和  $\text{NaHCO}_3$  溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥し、減圧濃縮した。標題の光学活性化合物 7 8 (光学活性 3 , 3 ' -ビス ( 3 , 4 , 5 , -トリフルオロフェニル ) - 4 , 6 , 4 ' , 6 ' -テトラメチル - 5 , 5 ' -ジメトキシビフェニル - 2 , 2 ' -ジメチルプロミド) ( 2 0 4 m g , 0 . 2 8 5 m m o l ) を定量的収率で得た。得られた光学活性化合物 7 8 の NMR スペクトルを表 4 5 に示す。

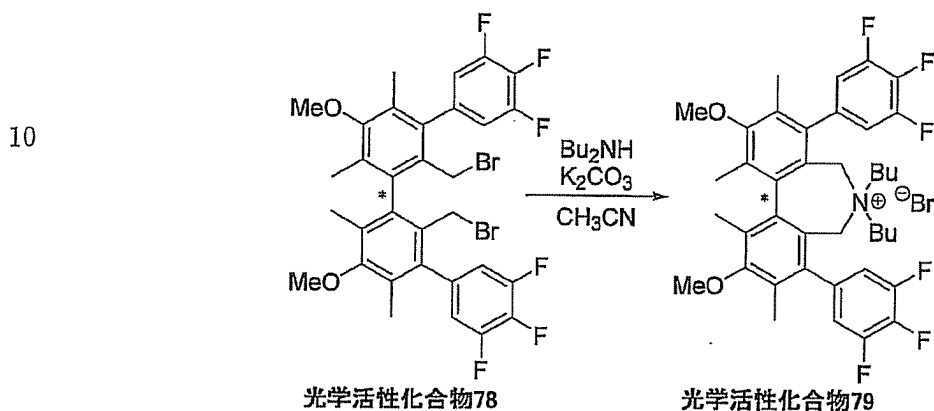
25

表 4 5

光学活性化合物78のNMRスペクトル
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 6.96 (4H, m, Ar-H), 3.91 (2H, d, $J = 10.0$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{Br}$ ), 3.83 (2H, d, $J = 10.0$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{Br}$ ), 3.78 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 2.02 (12H, s, $\text{CH}_3$ ).

5

<実施例 17 : 4級アンモニウム塩 (光学活性化合物 79) の合成>



15

参考例 42 で得られた光学活性化合物 78 (204 mg, 0.285 mmol) と炭酸カリウム (157 mg, 1.14 mmol) とのアセトニトリル懸濁液 (3 mL) に、窒素雰囲気下にてジブチルアミン (0.0728 mL, 0.427 mmol) を添加した。この反応混合物を 80°C で 3 時間加熱した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、メタノール/酢酸エチル = 1/5) で精製して、標題の光学活性な 4 級アンモニウムブロミド (光学活性化合物 79) を得た (132 mg, 0.173 mmol / 収率: 61%)。本実施例で得られた光学

20

25

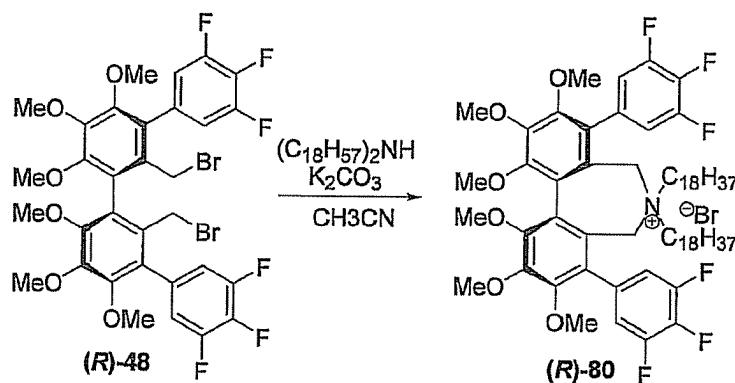
活性化合物 79 の NMR スペクトルを表 46 に示す。

表 4 6

## 実施例17で得られた光学活性化合物79のNMRスペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.24 (2H, m, Ar-H), 6.97 (2H, m, Ar-H), 4.19 (2H, d,  $J=13.5$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 3.88 (6H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 3.80 (2H, d,  $J=13.6$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 2.93 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 2.66 (2H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 2.13 (6H, s,  $\text{CH}_3$ ), 2.12 (6H, s,  $\text{CH}_3$ ), 1.15–1.00 (6H, m,  $\text{CH}_2$ ), 0.81 (6H, t,  $J=6.7$  Hz,  $\text{CH}_3$ ), 0.38 (2H, m,  $\text{CH}_2$ ).

## &lt;実施例18：4級アンモニウム塩（化合物（R）-80）の合成&gt;



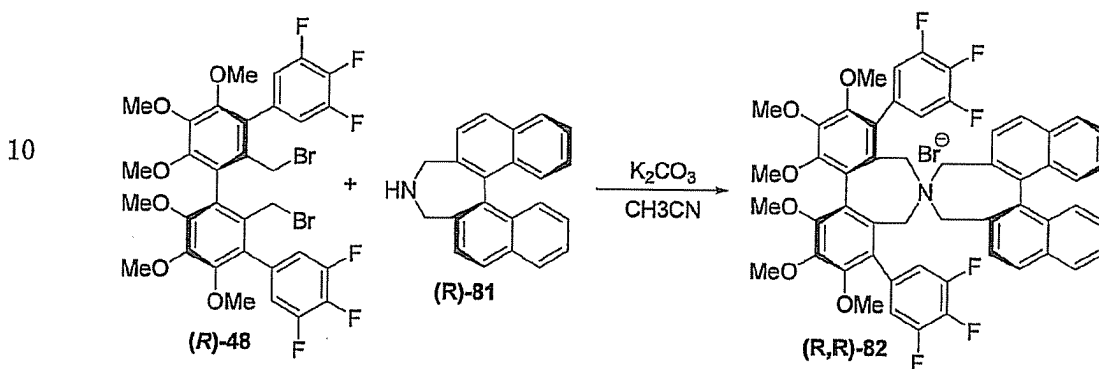
参考例15で得られた化合物（R）-48（156mg，0.2mmol）と炭酸カリウム（55mg，0.4mmol）とのアセトニトリル懸濁液（5mL）に、窒素雰囲気下にてジオクタデシルアミン（104mg，0.2mmol）を添加した。この反応混合物を80℃で10時間加熱した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液として、メタノール／トルエン＝1／5）で精製して、標題の光学活性な4級アンモニウムブロミド（化合物（R）-80）（R体）を得た（200mg，0.164mmol／収率：82%）。得られた化合物（R）-80のNMRスペクトルを表47に示す。

表 4 7

## 実施例18で得られた化合物(R)-80のNMRスペクトル

400 MHz  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.26 (2H, s, Ar-H), 7.00 (2H, s, Ar-H), 4.30 (2H, d,  $J = 13.4$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 4.03 (6H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 3.93 (6H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 3.87 (2H, d,  $J = 13.4$  Hz,  $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 3.75 (6H, s,  $\text{OCH}_3$ ), 2.84 (4H, m,  $\text{NCH}_2$ ), 1.30-1.03 (62H, m,  $\text{CH}_2$ ), 0.88 (6H, t,  $J = 7.0$  Hz,  $\text{CH}_3$ ), 0.23 (2H, m,  $\text{CH}_2$ ).

## &lt;実施例19：4級アンモニウム塩（化合物(R,R)-82）の合成&gt;



- 15 参考例15で得られた化合物(R)-40 (390mg, 0.5mmol)と炭酸カリウム(207mg, 1.5mmol)とのアセトニトリル懸濁液(20mL)に、窒素雰囲気下にて(R)-3,5-ジヒドロ-4H-ジナフト[2,1-c:1'2'-e]アゼピン(化合物(R)-81) (148mg, 0.5mmol)を添加した。この反応混合物を80℃で2時間加熱した。次いで、これを水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液として、メタノール/トルエン=1/4)で精製して、
- 20 標題の光学活性な4級アンモニウムブロミド(化合物(R,R)-82)(R,R体)を得た(0.48g, 0.48mmol/収率:96%)。得られた化合物(R,R)-82のNMRスペクトルを表48に示す。
- 25

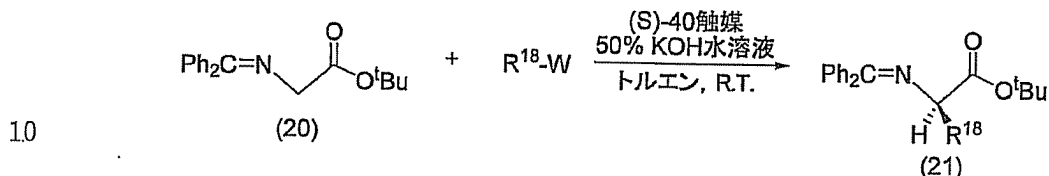


表 4 8

5

実施例19で得られた化合物(R, R)-82のNMRスペクトル	
400 MHz $^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 7.92 (2H, d, $J = 8.2$ Hz, Ar-H), 7.56-7.49 (4H, m, Ar-H), 7.27-7.10 (6H, m, Ar-H), 6.79 (2H, m, Ar-H), 6.46 (2H, d, $J = 8.4$ Hz, Ar-H), 4.63 (2H, d, $J = 13.7$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 4.41 (4H, t, $J = 14.0$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{N}$ ), 4.10 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.90 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.75 (6H, s, $\text{OCH}_3$ ), 3.60 (2H, d, $J = 13.0$ Hz, $\text{ArCH}_2\text{N}$ ).	

<実施例 20 : グリシンの  $\alpha$ -ベンジル化の確認 (90) >

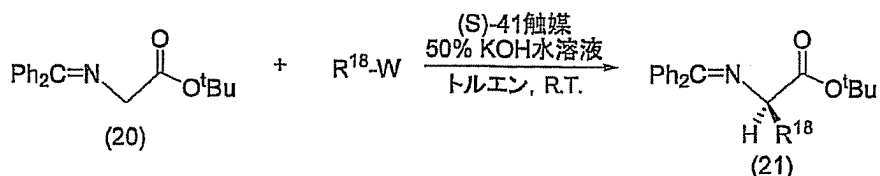


50% KOH水溶液 (1 mL) と N-(ジフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (化合物 20) (59.1 mg, 0.2 mmol) とのトルエン溶液 (1.5 mL) の混合物に、実施例 13 で得られた化合物 (S)-40 (1 モル%; 相間移動触媒) と上記式  $\text{R}^{18}\text{-W}$  で表される化合物としてベンジルブロミド (1.5 当量, 36  $\mu\text{L}$ , 0.3 mmol) との混合物を加え、アルゴン雰囲気下、室温にて激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、エーテルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、残渣のオイルをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、エーテル/ヘキサン=1/10) で精製して、対応する化合物 21 ((R)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン) フェニルアラニン) を得た (75.6 mg, 0.196 mmol/収率: 98%)。本実施例で得られた化合物 21 の光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール=100/1、流速 0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体=14.8 分、(S) 体=28.2 分]。本実施例で得られた化合物 21 の光学純度は 96% ee であった。

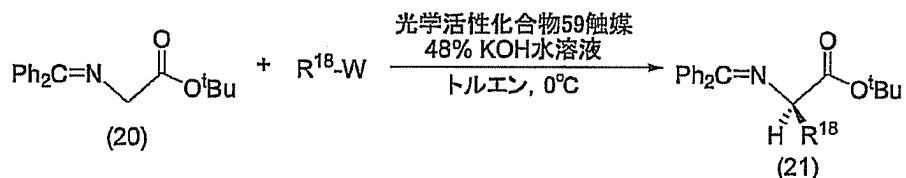
15

20

25

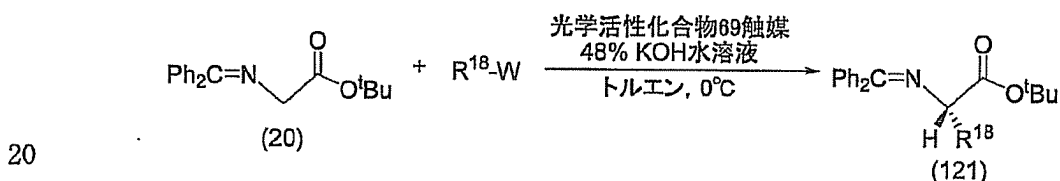
<実施例 21 : グリシンの  $\alpha$ -ベンジル化の確認 (91) >

- 5      50% KOH水溶液 (1 mL) と N-(ビフェニルメチレン) グリシン t  
 tert-ブチルエステル (化合物 20) (59.1 mg, 0.2 mmol)  
 のトルエン溶液 (1.5 mL) との混合物に、実施例 14 で得られた化合物  
 (S)-41 (1 モル%; 相間移動触媒) と上記式  $\text{R}^{18}\text{-W}$  で表される化合  
 物としてベンジルブロミド (1.5 当量, 36  $\mu\text{L}$ , 0.3 mmol) との  
 10      混合物を加え、アルゴン雰囲気下、室温にて激しく攪拌した。反応の終了を  
 TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、エーテルで抽出した。有機  
 抽出物を食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、  
 残渣のオイルをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、エー  
 テル/ヘキサン=1/10) で精製して、対応する化合物 21 ((R)-t  
 15      tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン) フェニルアラニン) を得た (7  
 6.3 mg, 0.198 mmol/収率: 99%)。本実施例で得られた化  
 合物 21 の光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiral  
 cell OD; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール=100/1、流速  
 0.5 mL/分; 保持時間: (R) 体=14.8 分、(S) 体=28.2  
 20      分]。本実施例で得られた化合物 21 の光学純度は 96% ee であった。

<実施例 22 : グリシンの  $\alpha$ -ベンジル化の確認 (92) >

48% KOH水溶液 (6.7 mL) と N- (ビフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (590 mg, 2 mmol) のトルエン溶液 (6.7 mL) との混合物に、実施例 15 で得られた光学活性化合物 59 (0.05 モル%; 相間移動触媒) と上記式 R<sup>18</sup>-W で表される化合物としてベンジルブロミド (1.05 当量, 250 μL, 2.1 mmol) との混合物を加え、0℃にて激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、(R)-tert-ブチル N- (ジフェニルメチレン) フェニルアラニンを得た (0.72 g, 1.86 mmol / 収率: 93%)。得られた (R)-tert-ブチル N- (ジフェニルメチレン) フェニルアラニンの光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD-H; 溶離液: ヘキサン / 2-プロパノール = 100 / 1、流速 1 mL / 分; 保持時間: (R) 体 = 9.2 分、(S) 体 = 15.6 分]。本実施例で得られた化合物 21 の光学純度は 97% ee であった。

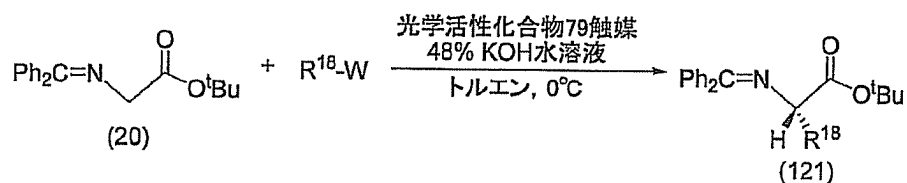
<実施例 23: グリシンの α-ベンジル化の確認 (93)>



48% KOH水溶液 (6.7 mL) と N- (ビフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (590 mg, 2 mmol) のトルエン溶液 (6.7 mL) の混合物に、実施例 16 で得られた光学活性化合物 69 (0.05 モル%; 相間移動触媒) と上記式 R<sup>18</sup>-W で表される化合物としてベンジルブロミド (1.05 当量, 250 μL, 2.1 mmol) との混合物を加え、0℃にて激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混

化合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、(R)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニンを得た (0.81g, 1.67mmol/収率: 84%)。得られた (S)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニンの光学純度を、HPLCにて分析した [Daicel Chiralcel OD-H; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール=100/1、流速1mL/分; 保持時間: (R)体=9.2分、(S)体=15.6分]。本実施例で得られた化合物121の光学純度は90% eeであった。

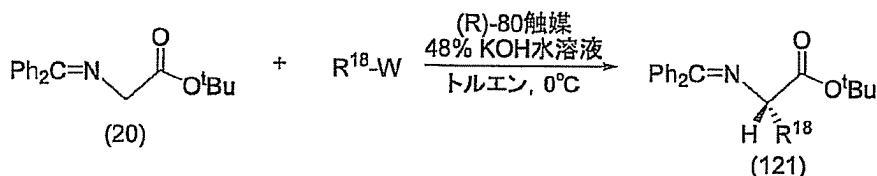
<実施例24: グリシンの $\alpha$ -ベンジル化の確認(94)>



48% KOH水溶液 (6.7mL) と N-(ジフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (590mg, 2mmol) のトルエン溶液 (6.7mL) との混合物に、実施例17で得られた光学活性化合物79 (0.05mol%; 相間移動触媒) と上記式 $\text{R}^{18}-\text{W}$ で表される化合物としてベンジルブロミド (1.05当量, 250 $\mu\text{L}$ , 2.1mmol) との混合物を加え、0 $^\circ\text{C}$ にて激しく攪拌した。反応の終了をTLCで確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、(S)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニンを得た (0.76g, 1.72mmol/収率: 86%)。得られた (S)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニンの光学純度を、HPLCにて分析した [Daicel Chiralcel OD-H; 溶離液: ヘキサン

／2-プロパノール＝100／1、流速1mL／分；保持時間：（R）体＝9.2分、（S）体＝15.6分]。本実施例で得られた化合物121の光学純度は97%eeであった。

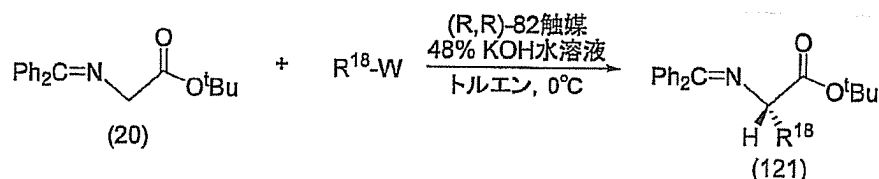
5      <実施例25：グリシンのα-ベンジル化の確認（95）>



10      48%KOH水溶液（6.7mL）とN-（ビフェニルメチレン）グリシン tert-ブチルエステル（590mg, 2mmol）のトルエン溶液（6.7mL）との混合物に、実施例18で得られた化合物（R）-80（0.05モル%；相間移動触媒）と上記式R<sup>18</sup>-Wで表される化合物としてベンジルブロミド（1.05当量, 250μL, 2.1mmol）との混合物を加え、0℃にて激しく攪拌した。反応の終了をTLCで確認した後、  
 15      反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、（S）-tert-ブチルN-（ジフェニルメチレン）フェニルアラニンを得た（0.75g, 1.82mmol／収率：91%）。得られた（S）-tert-ブチルN-  
 20      -（ジフェニルメチレン）フェニルアラニンの光学純度を、HPLCにて分析した [Daicel Chiralcel OD-H；溶離液：ヘキサン／2-プロパノール＝100／1、流速1mL／分；保持時間：（R）体＝9.2分、（S）体＝15.6分]。本実施例で得られた化合物121の光学純度は96%eeであった。

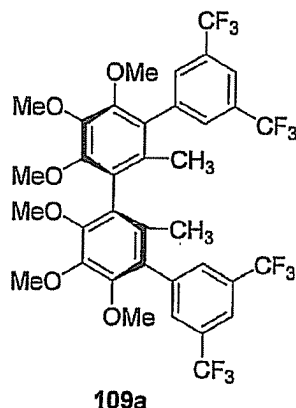
25

<実施例26：グリシンのα-ベンジル化の確認（96）>



- 48% KOH水溶液 (6.7 mL) と N-(ジフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (590 mg, 2 mmol) のトルエン溶液 (6.7 mL) との混合物に、実施例 19 で得られた化合物 (R,R)-82 (0.5 mol%; 相間移動触媒) と上記式 R<sup>18</sup>-W で表される化合物としてベンジルブロミド (1.05 当量, 250 μL, 2.1 mmol) との混合物を加え、0°C にて激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、(S)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン) フェニルアラニン (0.87 g, 2.0 mmol) を定量的収率で得た。得られた (S)-tert-ブチル N-(ジフェニルメチレン) フェニルアラニンの光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD-H; 溶離液: ヘキサン/2-プロパノール=100/1、流速 1 mL/分; 保持時間: (R) 体=9.2 分、(S) 体=15.6 分]。本実施例で得られた化合物 121 の光学純度は 96% ee であった。

- 20 <参考例 43: 4 級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物 109a) の合成>



参考例5で得られた化合物8a (0.26g, 0.5mmol)、3, 5-  
 ービストリフルオロメチルフェニルボロン酸 (0.516g, 2.0mmol)、酢酸パラジウム (0.0225g, 0.10mmol)、トリ-  
 ー  
 トリルホスフィン (0.122g, 0.40mmol)、リン酸カリウムn  
 5 水和物 (1.27g, 6.0mmol) およびTHF (7mL) の混合物を、  
 アルゴン雰囲気下75℃で加熱しながら攪拌した。出発物質の消失をTLC  
 で確認した後、懸濁液をアルミナとNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で濾過した。酢酸エチルで洗  
 いこんだ後に、有機層を1Nの塩酸で洗浄した。その後、有機層を減圧下に  
 濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、ヘ  
 10 キサン/酢酸エチル=10/1および5/1) で精製して、標題の化合物1  
 09a ((S)-3, 3'-ビス(3, 5-ビストリフルオロメチルフェニル)-4, 5, 6, 4', 5', 6'-ヘキサメトキシビフェニル-2,  
 2'-ジメタン) を得た (0.294g, 0.37mmol/収率: 7  
 5%)。得られた化合物109aのNMRスペクトルを以下の表49に示す。

15

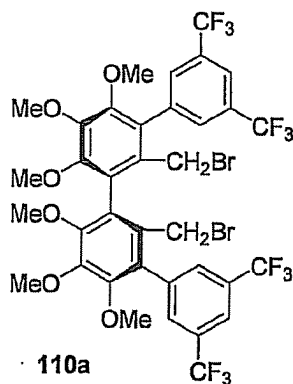
表49

化合物109aのNMRスペクトル
400 MHz <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 7.87 (2H, s, Ar-H), 7.75 (4H, d, J = 20 Hz, Ar-H), 3.95 (6H, s, OMe), 3.80 (6H, s, OMe), 3.71 (6H, s, OMe), 1.71 (6H, s, CH <sub>3</sub> )

20

<参考例44: 4級アンモニウム塩の合成のための出発物質 (化合物110a) の合成>

25

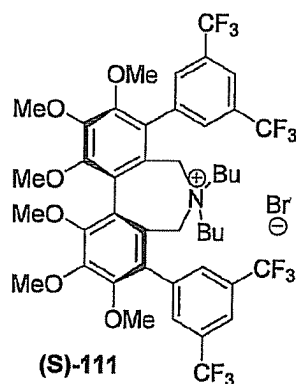


参考例 43 で得られた化合物 109a (0.079 g, 0.1 mmol)、  
 N-ブロモスクインイミド (0.04 g, 0.22 mmol) および 2,  
 2'-アゾビスイソブチロニトリル (AIBN; 0.0033 g, 0.02  
 mmol) のベンゼン (5 mL) 溶液を、還流下 4 時間加熱した。飽和 Na  
 2SO<sub>3</sub> 溶液を加えて反応をクエンチし、エーテルで抽出した。有機層を Na  
 2SO<sub>4</sub> で乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
 (溶出液として、ヘキサン/酢酸エチル=5/1) で精製して、標題の化  
 合物 110a ((S)-3,3'-ビス(3,5-ビストリフルオロメチル  
 フェニル)-4,5,6,4',5',6'-ヘキサメトキシビフェニル-  
 2,2'-ジメチルプロミド) (0.094 g, 0.1 mmol) を定量的  
 に得た。得られた化合物 110a の NMR スペクトルを以下の表 50 に示す。

表 50

化合物 110a の NMR スペクトル	
400 MHz <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> )	δ 7.95 (4H, d, J = 13 Hz, Ar-H), 7.87 (2H, s, Ar-H), 3.98 (6H, s, OMe), 3.80-3.95 (10H, m, OMe+CH <sub>2</sub> Br), 3.73 (6H, s, OMe)

<実施例 27: 4級アンモニウム塩 ((S)-111) の合成>

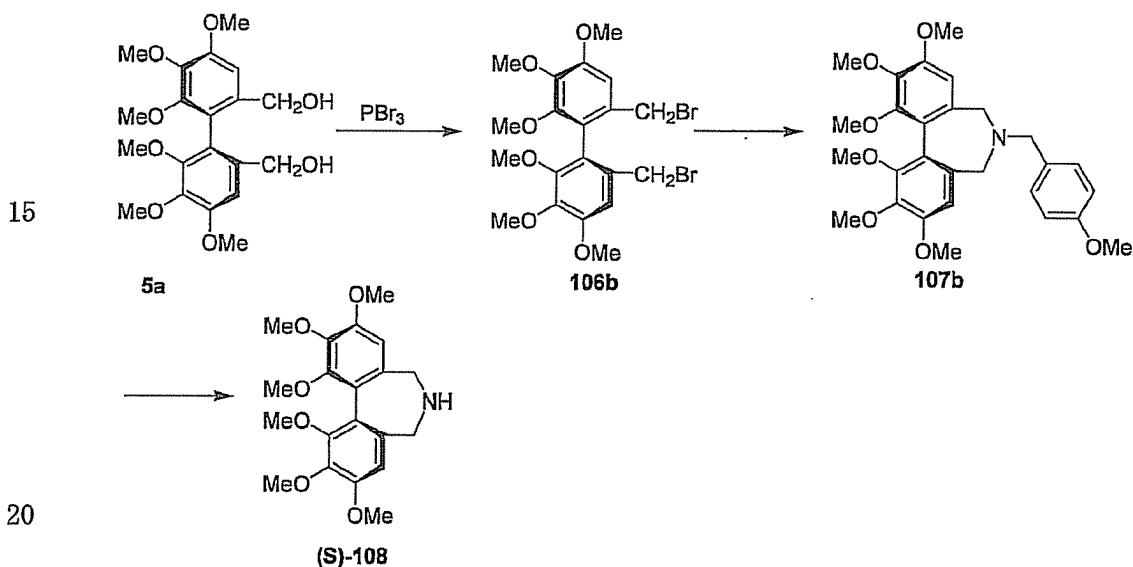


参考例 44 で得られた化合物 110a (0.094 g, 0.10 mmol) と炭酸カリウム (0.0166 g, 0.12 mmol) とのアセトニト



リル懸濁液（10 mL）に、アルゴン雰囲気下にてジブチルアミン（0.025 mL, 0.15 mmol）を添加した。この反応混合物を80℃で10時間加熱した。次いで、これを1NのHBr水溶液中に注ぎ、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>で抽出した。有機層をNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥して、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液として、メタノール/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>=1/20および1/10）で精製して、標題の光学活性な4級アンモニウムブロミド（化合物（S）-111）（S体）を得た（0.088 g, 0.088 mmol/収率：88%）。

＜参考例45：4級アンモニウム塩の合成のための出発物質（化合物（S）-108）の合成＞

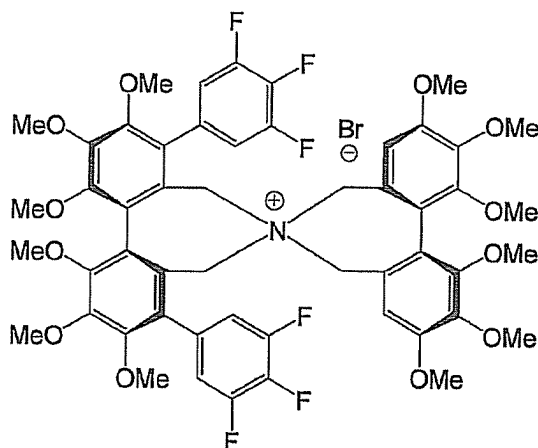


参考例3で得られた化合物5a（0.131 g, 0.33 mmol）のCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>（5 mL）溶液に、0℃にて三臭化リン（0.095 mL, 1.0 mmol）を添加した。反応混合物を室温で5時間攪拌した。次いで、これを水でクエンチし、ヘキサン/酢酸エチル（1/1）で抽出した。Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥し、減圧濃縮して、粗製の化合物106bを得た。

上記で得た全量の粗製の106bとp-メトキシベンジルアミンをTHF中一晩撹拌した。106bの消失を確認し、濃縮し、粗製の107bを得た(0.161g, 0.325mmol, 収率98%)。

上記で得た全量の粗製の107bのMeOH(5mL)溶液に、10%Pd/C(30mg)を加え、一晩、水素雰囲気下で撹拌した。セライト濾過後、濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液として、メタノール/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>=1/1)で精製して、標題の光学活性な2級アミン(S)-108(S体)を得た(0.118g, 0.31mmol/収率:95%)。

<実施例28:4級アンモニウム塩((S,S)-112)の合成>



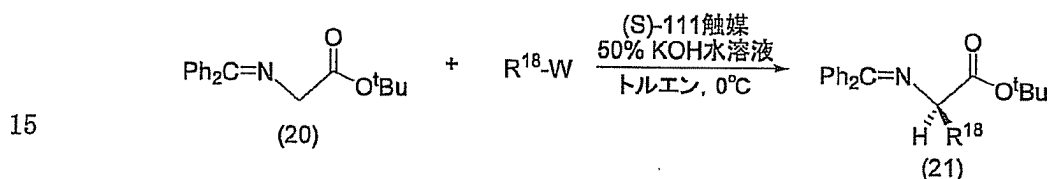
(S,S)-112

参考例9で得られた化合物5b(0.131g, 0.2mmol)のCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>(5mL)溶液に、0℃にて三臭化リン(0.038mL, 0.4mmol)を添加した。反応混合物を室温で1時間撹拌した。次いで、これを水でクエンチし、エーテルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥し、減圧濃縮して、粗製の化合物6bを定量的に得た。

上記の粗製化合物6bの一部(0.0245g, 0.031mmol)を、

アルゴン雰囲気下、炭酸カリウム (0.069 g, 0.5 mmol) と参考例 45 で得た 2 級アミン (S) - 108 (0.014 g, 0.038 mmol) とのアセトニトリル懸濁液 (2 mL) に移した。次いで、この混合物を 40°C で 10 時間加熱した。反応混合物を 1 N の HBr に注いでクエンチし、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> で抽出した。有機層を Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、メタノール/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> = 1/10) により精製して、標題の光学活性な 4 級アンモニウムブロミド (化合物 (S, S) - 112) (S, S 体) を得た (0.029 g, 0.027 mmol / 収率: 87%)。得られた化合物 112 のマスペクトルは次のとおりであった: M<sup>+</sup> = 994.46。

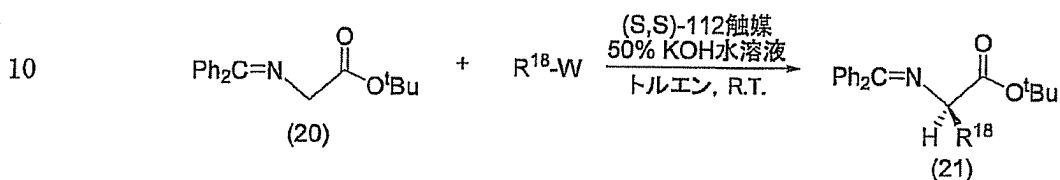
<実施例 29: グリシンの α-ベンジル化の確認 (211)>



50% KOH 水溶液 (1 mL) と N-(ビフェニルメチレン) グリシン tert-ブチルエステル (化合物 20) (59.1 mg, 0.2 mmol) のトルエン溶液 (1.5 mL) との混合物に、実施例 27 で得られた化合物 (S) - 111 (1 モル%; 相間移動触媒) と上記式 R<sup>18</sup>-W で表される化合物としてベンジルブロミド (1.5 当量, 36 μL, 0.3 mmol) との混合物を加え、アルゴン雰囲気下、0°C にて激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、エーテルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、残渣のオイルをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出液として、エーテル/ヘキサン = 1/10) で精製して、対応する化合物 21 ((R) - t

tert-ブチルN-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニン)を得た(6  
8.6mg, 0.178mmol/収率:89%)。本実施例で得られた化  
合物21の光学純度を、HPLCにて分析した[Dai-  
cel Chiralcel OD; 溶離液:ヘキサン/2-プロパノール=100/1、流速  
5 0.5mL/分; 保持時間:(R)体=14.8分、(S)体=28.2  
分]。本実施例で得られた化合物21の光学純度は95% eeであった。

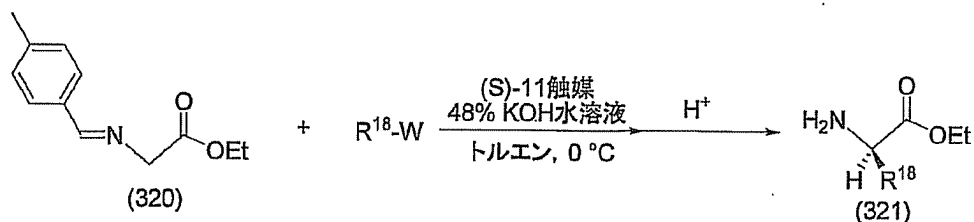
<実施例30:グリシンの $\alpha$ -ベンジル化の確認(212)>



50%KOH水溶液(1mL)とN-(ビフェニルメチレン)グリシン  
tert-ブチルエステル(化合物20)(59.1mg, 0.2mmol)  
15 のトルエン溶液(1.5mL)との混合物に、実施例28で得られた化合物  
(S,S)-112(1mol%; 相間移動触媒)と上記式R<sup>18</sup>-Wで表され  
る化合物としてベンジルブロミド(1.5当量, 36 $\mu$ L, 0.3mmol  
1)との混合物を加え、アルゴン雰囲気下、室温にて激しく攪拌した。反応  
の終了をTLCで確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、エーテルで抽出し  
20 た。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥した。溶媒を減圧留去  
した後、残渣のオイルをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液とし  
て、エーテル/ヘキサン=1/10)で精製して、対応する化合物21  
( (R)-tert-ブチルN-(ジフェニルメチレン)フェニルアラニン)  
を得た(72.5mg, 0.188mmol/収率:94%)。本実施  
25 例で得られた化合物21の光学純度を、HPLCにて分析した[Dai-  
cel Chiralcel OD; 溶離液:ヘキサン/2-プロパノール=1

0.0 / 1、流速 0.5 mL / 分；保持時間：(R) 体 = 14.8 分、(S) 体 = 28.2 分]。本実施例で得られた化合物 21 の光学純度は 77% ee であった。

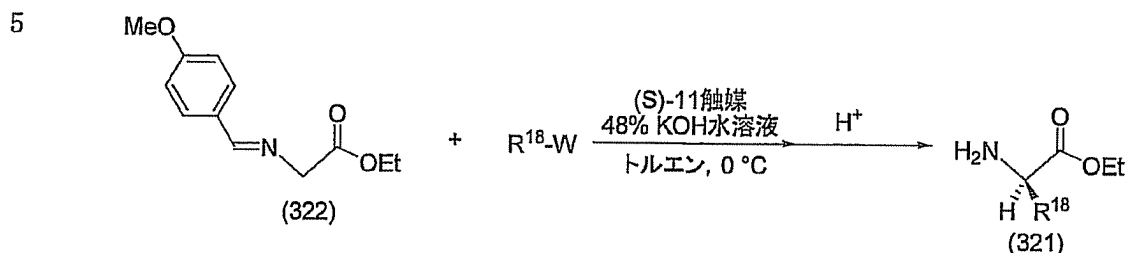
5 <実施例 31：グリシンの  $\alpha$ -ベンジル化の確認 (31)>



- 10 実施例 2 で得られた化合物 (S)-11 (0.1 モル%；相間移動触媒) と上記式  $R^{18}-W$  で表される化合物としてベンジルブロミド (1.37 当量, 1.63 mL, 13.7 mmol) と N-(4-メチルフェニルメチレン)グリシンエチルエステル (2.05 g, 10 mmol) のトルエン溶液 (10 mL) との混合物に、48% KOH 水溶液 (2.3 g) を加え、0°C にて
- 15 激しく攪拌した。反応の終了を TLC で確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、 $Na_2SO_4$  で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、1 N の塩酸 (20 mL) を添加し、室温にて 1 時間攪拌した。トルエン (20 mL  $\times$  3) で水層を洗浄し、発泡に気をつけながら、溶液が pH 11 以上 (ユニバーサル pH 試験紙で確認した) に
- 20 なるまで炭酸ナトリウムを添加した後、酢酸エチル (20 mL  $\times$  3) で抽出した。得られた酢酸エチル溶液を、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮して、標題の化合物 321 ((R)-フェニルアラニンエチルエステル) を得た (1.18 g, 6.11 mmol / 収率: 61%)。得られた (R)-フェニルアラニンエチルエステルの光学純度を、HPLC にて分析した [Daicel Chiralcel OD-H；溶離液：ヘキサン / 2-プロパノール / ジエチルアミン = 98 / 2 / 0.1、流速 0.5 mL / 分；保持
- 25

時間：(R) 体＝23.2分、(S) 体＝24.9分]。本実施例で得られた化合物321の光学純度は77% eeであった。

<実施例32：グリシンの $\alpha$ -ベンジル化の確認(31)>



- 10 実施例2で得られた化合物(S)-11(0.1モル%；相間移動触媒)と上記式R<sup>18</sup>-Wで表される化合物としてベンジルブロミド(1.37当量, 1.63 mL, 13.7 mmol)とN-(4-メトキシフェニルメチレン)グリシンエチルエステル(2.05 g, 10 mmol)のトルエン溶液(10 mL)との混合物に、48% KOH水溶液(2.3 g)を加え、0℃
- 15 にて激しく攪拌した。反応の終了をTLCで確認した後、反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機抽出物を食塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥した。溶媒を減圧留去した後、1 Nの塩酸(20 mL)を添加し、室温にて1時間攪拌した。トルエン(20 mL×3)で水層を洗浄し、発泡に気をつけながら、溶液がpH 11以上(ユニバーサルpH試験紙で確認し
- 20 た)になるまで炭酸ナトリウムを添加した後、酢酸エチル(20 mL×3)で抽出した。得られた酢酸エチル溶液を、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮して、標題の化合物321((R)-フェニルアラニンエチルエステル)を得た(1.32 g, 6.83 mmol/収率：68%)。得られた(R)-フェニルアラニンエチルエステルの光学純度を、HPLCにて分析
- 25 した[Dai cel Chiral cel OD-H；溶離液：ヘキサン／2-プロパノール／ジエチルアミン＝98／2／0.1、流速0.5 mL／

分；保持時間：（R）体＝23.2分、（S）体＝24.9分]。本実施例で得られた化合物321の光学純度は74% eeであった。

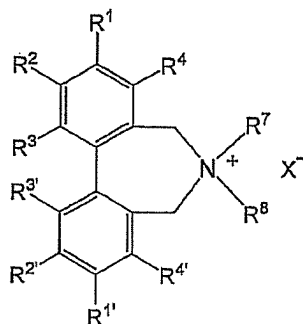
#### 産業上の利用可能性

- 5       本発明によれば、より単純な構造のキラル相間移動触媒が提供される。この相間移動触媒は、従来の化合物よりもより少ない工程により製造することができ、このことはコストの削減にもつながる。このような相間移動触媒は、 $\alpha$ -アルキル- $\alpha$ -アミノ酸およびその誘導体および $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジアルキル- $\alpha$ -アミノ酸およびその誘導体の合成に非常に有用である。このようにして
- 10       合成されるアミノ酸およびその誘導体は、増強された活性（薬理的、生理活性など）を有するペプチドの設計において、および有効な酵素インヒビターとして、ならびに種々の生物学的活性を有する化合物の合成用キラルビルディングブロックとして、重要で特別な役割を果たす。したがって、新規な食品や医薬品の開発に有用である。

## 請求の範囲

1. 以下の式 (I) で表される、化合物：

5



(I)

10. ここで、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、および $R^{2'}$ は、それぞれ独立して、

水素原子であるか；

ハロゲン原子であるか；

15. ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および  
／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルキル基である  
か；あるいは

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および  
／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基；であ  
り、

20.  $R^3$ および $R^{3'}$ は、それぞれ独立して、

ハロゲン原子であるか；

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および  
／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルキル基である  
か；あるいは

25. ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および  
／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基；であ



り、

$R^4$ および $R^{4'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

5 (ii)  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

(v)カルバモイル基；

10 (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(viii)  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)；

(ix)ハロゲン原子；

15 (x)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(xi)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

20 (xii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xiii)アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリアル部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
 5  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

10  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基；

(xiv)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$   
 25 アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$

アルコキシ基、

- 5      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されているもよい、アリール基、

- 10      シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

- 15      カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

- 20      ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されているもよい、ヘテロアラールキル基；

(xv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

- 25      分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されているもよい $C_1 \sim C_5$

アルコキシ基、

- 5      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていて  
 もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ およ  
 び $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され  
 ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$   
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していても  
 よくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
 で置換されていてよい、アリール基、

- 10      シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素  
 原子か、またはハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
 である）、

ニトロ基、

- 15      カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
 置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

- 20      ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよいか、  
 あるいは3, 4位が一緒になって $-O-(CH_2)_p-O-$ （ここで、 $p$ は1  
 または2である）で置換されていてよい、アリール基；

(xvi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

- 25      分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$   
 アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

5      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
10      で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

15      ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および  
20      ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(xvii)  $-S(O)_n-R$ （ここで、 $n$ は0、1、または2であり、そして  
25       $R$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）；

からなる群より選択される基であり、

$R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して、

(i)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{30}$ のアルキル基；

5 (ii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv)アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
20 で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
25 である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5      -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基;

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10      分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$   
アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$   
アルコキシ基、

15      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい  
てもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およ  
びR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され  
ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していても  
20      よくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)  
で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素  
原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
25      である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5     $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基；

10    (vi) - ( $CH_2$ )<sub>n</sub> OCONR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> (ここで、 $R^{10}$ および $R^{11}$ はそれぞ  
れ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
~ $C_4$ アルキル基、

15    (3) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換され  
ていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換され  
ていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分  
が

20    分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
~ $C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
~ $C_5$ アルコキシ基、

25    ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$   
および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換



- 5    $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、  
       シアノ基、  
        $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、  
 10   ニトロ基、  
       カルバモイル基、  
        $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
        $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
        $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子  
 15   子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
       ハロゲン原子  
       からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、  
       ラルキル基；  
       (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロラルキル基であって、該ヘ  
 20   テロアリール部分が、  
       分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
       分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、  
 25   ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
       いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ ア  
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 リール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ ア  
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
 る) ;

(vii)  $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$ (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞ  
 れ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$   
および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
10 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  ア  
ルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐してい  
てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基であ  
る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、  
水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル  
基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原  
子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$   
および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル  
10 基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ ア  
ルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐してい  
てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基であ  
る）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル  
基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(viii) —  $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^{12} \text{COR}^{13}$  (ここで、 $\text{R}^{12}$  および  $\text{R}^{13}$  はそれぞれ独立して、

5 (1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{30} \text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$  および  $\text{R}^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $\text{N}$ ,  $\text{N}$ -ジ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-\text{NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20  $-\text{NR}^{30} \text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$  および  $\text{R}^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基かである)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

5                   ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10                   分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

15                   ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20                   シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

25                   ニトロ基、

カルバモイル基、



N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

5           ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

10       (ix) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup> (ここで、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

15       (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

20       ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基 ; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基であ

25

る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ

25

る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、  
5 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル  
基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

10 —NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原  
子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ  
る) ;

(x)—(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Y—OR<sup>12</sup> (ここで、Yは分岐していてもよくかつハロ  
ゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>の二価の飽和炭化水素基であり、  
R<sup>12</sup>は、

20 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>  
～C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>

25 ～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>

～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>

～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

25 (xi)  $-(CH_2)_n-OR^{12}$ （ここで、R<sup>12</sup>は、

(1)水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$  ~  $C_4$  アルキル基である)、およびハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$

5  $\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$

$\sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$

10 および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

20 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原

25 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

5 (xii) — (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> — S — R<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub>アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基; N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

25

ニトロ基、



カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子

5 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

25

ニトロ基、

- カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;  
 (xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO - R<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、  
 (1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 (3)アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基であ

る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ

25

る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、  
水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル  
基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

10  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原  
子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数であ  
る) ; ならびに

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$   
20  $\sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$   
 $\sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$   
25  $\sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて

いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて

いてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

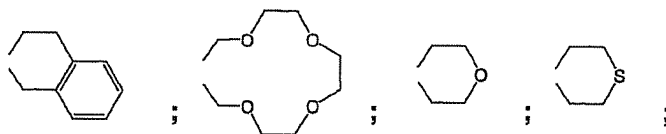
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である) ;

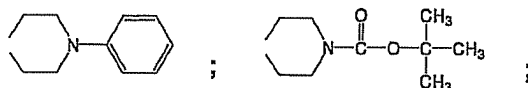
からなる群より選択される基であるか、あるいは、

$R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は2から8の整数である) ;

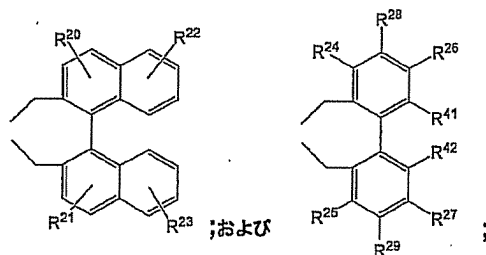
276



5



10



(ここで、 $R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{29}$ 、 $R^{41}$ 、および $R^{42}$ はそれぞれ独立して、  
水素原子；

15

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ アルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル基；

20

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ ア

25

ルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリアル基；

5       ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリアル部分を有する、ヘテロアリアル基；

10       ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリアル部分を有する、アラルキル基；

15       ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリアル部分を有する、ヘテロアラルキル基；

      ( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) カルボニル基；

25       カルバモイル基；

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；ならびに



N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基 (ここで、 $C_1 \sim C_4$  アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい) からなる群より選択される基である)

からなる群より選択される二価の基を表し、そして

- 5  $X^-$  は、ハロゲン化物アニオン、 $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、 $HF_2^-$ 、 $CF_3SO_3^-$ 、 $CH_3-Ph-SO_3^-$ 、および  $CH_3SO_3^-$  からなる群より選択されるアニオンである。

- 10 2. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、および  $R^{3'}$  のすべてが、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基である、請求項 1 に記載の化合物。

- 15 3. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、および  $R^{3'}$  のすべてがメトキシ基、エトキシ基、またはベンジルオキシ基である、請求項 1 に記載の化合物。

4. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^4$  および  $R^{4'}$  が、それぞれ独立して、水素原子；ならびに

アリール基であって、該アリール基が

- 20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

- 25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され

ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されて

5 ていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

15

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

からなる群より選択される基である、請求項1から3のいずれかに記載の化合物。

20

5. 前記式(I)で表される化合物の $R^4$ および $R^{4'}$ が3, 4, 5-トリフルオロフェニル基または3, 5-ビストリフルオロメチルフェニルである、請求項4に記載の化合物。

25

6. 前記式(I)で表される化合物の $R^7$ および $R^8$ がそれぞれ独立して、分

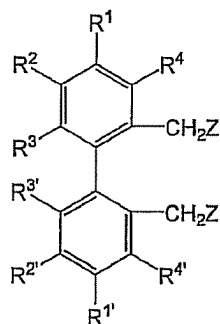
岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、  
 $C_1 \sim C_{30}$ のアルキル基である、請求項1から5のいずれかに記載の化合物。

7. 前記式(I)で表される化合物の $R^7$ および $R^8$ がともにn-ブチル基で  
 5 ある、請求項6に記載の化合物。

8. 請求項1に記載の、式(I)で表される化合物を製造するための方法で  
 あって、

以下の式(II)：

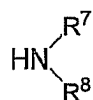
10



15

(II)

で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、  
 以下の式(III)：



20

(III)

で表される2級アミンと反応させる工程、を包含し、  
 ここで、式(II)において、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、および $R^{2'}$ は、それぞれ独立して、

水素原子であるか；

25

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および  
 ／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルキル基である

か；あるいは

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基；であり、

5  $R^3$ および $R^{3'}$ は、それぞれ独立して、

ハロゲン原子であるか；

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルキル基であるか；あるいは

10 ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基；であり、

$R^4$ および $R^{4'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

15 (ii)  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）；

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

20 (v)カルバモイル基；

(vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(viii)  $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）；

25 (ix)ハロゲン原子；

(x)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい

てもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(xi)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xiii)アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

(xiv)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 20 で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

25 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

5       ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

(xv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>

10       アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)

15       で置換されていてもよい、アリール基、

20       シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

25       ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

5       ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、あるいは3, 4位が一緒になって-O- ( $CH_2$ )<sub>p</sub>-O- (ここで、p は1 または2である) で置換されていてもよい、アリール基;

(xvi) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10       分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

15       ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup> および R<sup>31</sup> は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup> および R<sup>31</sup> は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

25

ニトロ基、



カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で

5 置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基; ならびに

(xvii) -S (O)<sub>n</sub>-R (ここで、nは0、1、または2であり、そして

10 Rは分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) ;

からなる群より選択される基であり、そして

Zはハロゲン原子であり、

そして式 (I I I) において、

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して、

15 (i) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>1</sub>~C<sub>30</sub>のアルキル基;

(ii) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>のアルケニル基;

20 (iii) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>2</sub>~C<sub>12</sub>のアルキニル基;

(iv) アリアル基であって、該アリアル基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

25 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい

もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基；

(v)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい

もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

(vi)  $-(CH_2)_n OCONR^{10}R^{11}$ （ここで、 $R^{10}$ および $R^{11}$ はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換され

ていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(4)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

5 が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

10 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

25  $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原

子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

- 5 (6)ヘテロアリアル部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリアル部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

- 10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

- ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリアル基、

シアノ基、

- 20  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

- 25  $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 $N,N$ -ジ $(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$\text{-NHCO}R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

5 テロアラルキル基;

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
15  $\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル)カルバモイル基}$ ;  $\text{N}$ ,  $\text{N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル)カルバモイル基}$ 、または $\text{-NHCO}R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20  $\text{-NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25  $\text{N-(C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル)カルバモイル基}$ 、

$\text{N}$ ,  $\text{N-ジ(C}_1 \sim \text{C}_4\text{アルキル)カルバモイル基}$ 、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

5 リール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 —NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

$-\text{NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

5 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

(vii)  $-(\text{CH}_2)_n \text{CONR}^{12} \text{R}^{13}$  (ここで、 $\text{R}^{12}$ および $\text{R}^{13}$ はそれぞれ独立して、

10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{30} \text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基;  $\text{N}, \text{N}-\text{ジ}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-\text{NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、



$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

15 (viii)  $-(CH_2)_nNR^{12}COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ア}$   
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCO R^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N$ 、 $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ ア  
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
 る) ;

(ix)  $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$ (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ独立  
 して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$   
 $\sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
 10  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(x) —  $(CH_2)_n Y - OR^{12}$  (ここで、 $Y$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、

5  $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原

5 子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

15 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

25

ニトロ基、



- カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子  
 5 子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ  
 10 る) ;  
 (xi) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OR<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、  
 (1)水素原子、  
 (2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>  
 ~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 15 (3)アリール基であって、該アリール基が  
 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>  
 ~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>  
 ~C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>  
 およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ア  
 25 ルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基であ

る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、  
水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
5 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

10 —NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子  
で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>  
およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
基、N—(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基; N, N—ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
25 キル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐してい  
てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基であ

る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

(xii)  $-(CH_2)_n-S-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$

および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ ア  
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
 る) ;

(xiii)  $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$ (ここで、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$

$\sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_5$ アルコキシ基、

- 5           ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- 15            $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

- 20            $N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

25

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_5$ アルコキシ基、

- 5           ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- 15            $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

- 20            $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

- 25           テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ

る) ; ならびに

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$

5  $\sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$   
 $\sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$   
 10  $\sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$   
 および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 15 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  ア  
 ルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基であ  
 る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、



—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

5 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 —NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

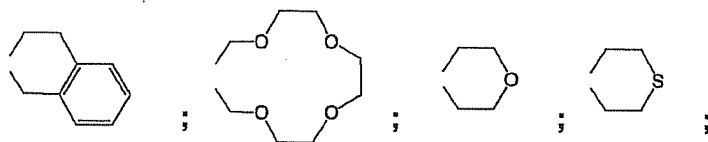
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

5 テロアリール基、

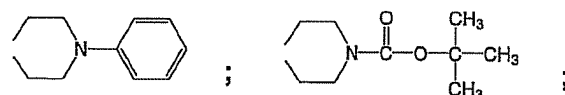
からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

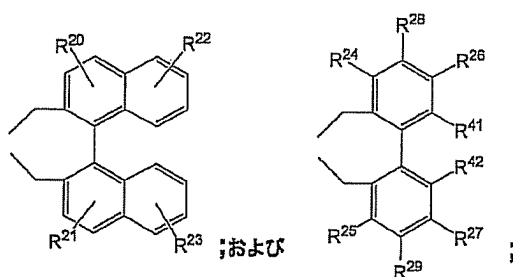
R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は一緒になって、—(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>—（ここで、mは2から8の  
10 整数である）；



15



20



（ここで、R<sup>20</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>23</sup>、R<sup>24</sup>、R<sup>25</sup>、R<sup>26</sup>、R<sup>27</sup>、R<sup>28</sup>、  
R<sup>29</sup>、R<sup>41</sup>、およびR<sup>42</sup>はそれぞれ独立して、

25 水素原子；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換

されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ アルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル基；

5 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基；

15 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

20 ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、アラルキル基；

25

- ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール部分を有する、ヘテロラルキル基；

( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) カルボニル基；

カルバモイル基；

- 10 N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基；ならびに

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基（ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい）からなる群より選択される基である）

からなる群より選択される二価の基を表す、方法。

15

9. 前記式 (I I) で表される化合物の $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、および $R^{3'}$ のすべてが、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基である、請求項8に記載の方法。

20

10. 前記式 (I I) で表される化合物の $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、および $R^{3'}$ のすべてがメトキシ基、エトキシ基、またはベンジルオキシ基である、請求項8に記載の方法。

25

11. 前記式 (I I) で表される化合物の $R^4$ および $R^{4'}$ が、それぞれ独立して、

水素原子；ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
10  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N,N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

20  $N,N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

25

からなる群より選択される基である、請求項8から10のいずれかに記載

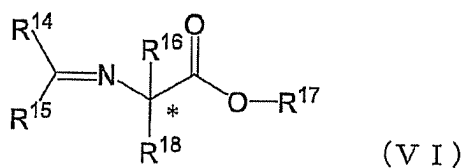
の方法。

12. 前記式 (I I) で表される化合物の  $R^4$  および  $R^{4'}$  が 3, 4, 5-トリフルオロフェニル基または 3, 5-ビストリフルオロメチルフェニル基である、請求項 11 に記載の方法。

13. 前記式 (I I I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{30}$  のアルキル基である、請求項 8 から 12 のいずれかに記載の方法。

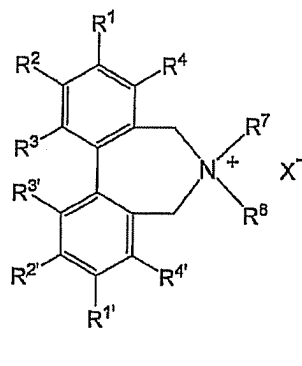
14. 前記式 (I I I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  がともに  $n$ -ブチル基である、請求項 13 に記載の方法。

15. 式 (V I) で表される化合物：

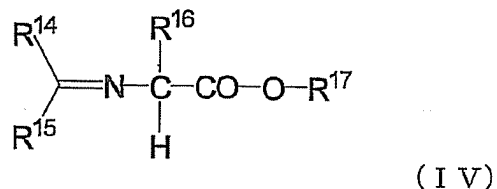


を立体選択的に製造するための方法であって、

20 軸不斉に関して純粋な式 (I)：



で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (I V) で表される化合物：



を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物：



でアルキル化する工程、を包含し、

ここで、式 (I) において、

10  $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^{1'}$ 、 $\text{R}^2$ 、および  $\text{R}^{2'}$  は、それぞれ独立して、

水素原子であるか；

ハロゲン原子であるか；

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルキル基である

15 か；あるいは

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基；であり、

$\text{R}^3$  および  $\text{R}^{3'}$  は、それぞれ独立して、

20 ハロゲン原子であるか；

ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルキル基である

か；あるいは

25 ハロゲン原子および／またはアリール基で置換されていてもよく、および／または分岐または環を形成していてもよい、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$  アルコキシ基；であり、

り、

$R^4$ および $R^{4'}$ は、それぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii)  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである) ；

(iii)シアノ基；

(iv)ニトロ基；

(v)カルバモイル基；

(vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(vii)  $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基；

(viii)  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) ；

(ix)ハロゲン原子；

(x)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基；

(xi)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(xii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(xiii)アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい



もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラールキル基；

(xiv)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラールキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていて  
 もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ およ  
 び $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され  
 ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
 5  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$   
 $N$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していても  
 よくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
 で置換されていてよい、アリール基、

シアノ基、

10  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素  
 原子か、またはハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
 である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
 置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘ  
 テロアラルキル基；

(xv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$   
 アルキル基、

25 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_5$   
 アルコキシ基、

- ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていて  
もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ およ  
び $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され  
ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
5  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$   
カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していても  
よくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
で置換されていてよい、アリール基、

シアノ基、

- 10  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素  
原子か、またはハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

- 15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および  
ハロゲン原子

- 20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよいか、  
あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_p-O-$ （ここで、 $p$ は1  
または2である）で置換されていてよい、アリール基；

(xvi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

- 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$   
25 アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_5$

アルコキシ基、

5      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていて  
       もよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ およ  
       び $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換され  
       ていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
       N-（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、N、N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキ  
       ル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していても  
       よくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）  
       で置換されていてよい、アリール基、

10      シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素  
       原子か、またはハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か  
       である）、

      ニトロ基、

15      カルバモイル基、

      N-（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

      N、N-ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
       置換されていてよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

20      ハロゲン原子

      からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてよい、ヘ  
       テロアリール基；ならびに

      (xvii)  $-S(O)_n-R$ （ここで、 $n$ は0、1、または2であり、そして  
       Rは分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてよい $C_1 \sim C_4$   
       アルキル基である）；

      からなる群より選択される基であり、

$R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、

$X^-$ は、ハロゲン化物アニオンであり、

式 (I V) および式 (V I) において、

5  $R^{14}$ および $R^{15}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

(ii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N,N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；であり、ただし  $R^{14}$  および  $R^{15}$  がともに水素原子である場合を除き、

$R^{16}$  は、

(i) 水素原子；

- 10 (ii) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_{10}$  のアルキル基であって、該アルキル基が、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

シアノ基、

- 15  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

- 20  $N- (C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ハロゲン原子

- 25  $-COR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

$-\text{CO}_2\text{R}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アルキル基;

- 5 (iii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ のアルケニル基;

(iv)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ のアルキニル基;

- (v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ基、

- ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
15  $\text{N}-(\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、 $\text{N}$ 、 $\text{N}-\text{ジ}(\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-\text{NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である)  
20 で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- $-\text{NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基かである)、  
25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

5      -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基;

10      (vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

15      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20      -NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、



- ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
5      -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；
- 10      (vii)アリール基であって、該アリール基が  
分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、
- 15      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)  
20      で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素  
25      原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

- ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
5      -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基; ならびに
- 10      (viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、
- 15      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)  
20      で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素  
25      原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

- ニトロ基、  
カルバモイル基、  
N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
5      -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で  
置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基；  
10      からなる群より選択される基であり、  
R<sup>17</sup>は、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル基であり、  
式 (V) および式 (VI) において、  
R<sup>18</sup>は、  
15      (i) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されてい  
てもよいC<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>のアルキル基であって、該アルキル基が、  
分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>  
アルコキシ基、  
シアノ基、  
20      -NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素  
原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基か  
である)、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
25      N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ハロゲン原子

5 —COR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

—CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アルキル基；

10 (ii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>3</sub>～C<sub>9</sub>のアリル基または置換アリル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>のアルケニル基；

15 (iv)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>のアルキニル基；

(v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリアル部分が分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、

25 N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N、N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していても

よくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)  
で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

5  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

10  $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラ  
15 ルキル基；

(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されて  
25 いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル) カルバモイル基、または $\text{—NHCOR}^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- 5  $\text{—NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

- 10  $\text{N—}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、  
 $\text{N, N—ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、  
 $\text{—NHCOR}^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
ハロゲン原子

- 15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラキル基；ならびに

(vii)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_9 \sim C_{99}$ のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

- 20 式 (V) において、  
Wは、脱離能を有する官能基であり、  
そして式 (VI) において

\*は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

- 25 16. 前記式 (I) で表される化合物の $R^7$ および $R^8$ が、  
それぞれ独立して、

(i)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{30}$ のアルキル基；

(ii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルケニル基；

5 (iii)分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$ のアルキニル基；

(iv)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、  
15  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

(v) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

- 10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

- 20 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

- 25 カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、



N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

(vi)  $-(CH_2)_n OCONR^{10}R^{11}$  (ここで、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

- 10 (2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基;

- (4) 分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基;

15 (5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

- 20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  ア

ルキル) カルバモイル基、または $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

- 5  $\text{-NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基かである) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

- 10  $\text{N- (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{N, N-ジ (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{-NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である) 、および  
 ハロゲン原子

- 15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

- 20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_5$ アルコキシ基、

- 25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{30}\text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基かである) 、ニトロ基、カルバモイル

基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである) 、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) 、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである) 、ニトロ基、カルバモイル

基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基 ; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5

シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである) 、

ニトロ基、

10

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) 、および

15

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

20

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである) 、ニトロ基、カルバモイル

25

基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

10 カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

15 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である) ;

20 (vii)  $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

25 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1$

～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

5      ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>  
 およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル  
 基、N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ア  
 ルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐してい  
 10      てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基であ  
 る）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15       $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル  
 基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

20       $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 リール基、ならびに

25      (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>

～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

5       ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>  
 およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル  
 基、N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ア  
 ルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐してい  
 10       てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基であ  
 る）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15        $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル  
 基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N-（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N-ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

20        $-NHCOR^9$ （ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

25       からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ  
 る）；

(viii) —  $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^{12} \text{COR}^{13}$  (ここで、 $\text{R}^{12}$ および $\text{R}^{13}$ はそれぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1$

5  $\sim \text{C}_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1$   
 $\sim \text{C}_4$  アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1$

10  $\sim \text{C}_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
 いてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基、シアノ基、 $-\text{NR}^{30} \text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$   
 および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
 されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 15 基、 $\text{N}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基； $\text{N}$ 、 $\text{N}$ -ジ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  ア  
 ルキル) カルバモイル基、または $-\text{NHCOR}^9$  (ここで、 $\text{R}^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル基であ  
 る) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20  $-\text{NR}^{30} \text{R}^{31}$  (ここで、 $\text{R}^{30}$ および $\text{R}^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル  
 基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25  $\text{N}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$\text{N}$ 、 $\text{N}$ -ジ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$  アルキル) カルバモイル基、



—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

5 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基；N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 —NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

- からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基、  
 5 からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(ix) —(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>（ここで、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立して、

- 10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリアル基であって、該アリアル基が

- 15 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

- ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>（ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基；N，N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリアル基、  
 20  
 25

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

15

$(x)-(CH_2)_nY-OR^{12}$  (ここで、 $Y$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$

20

$\sim C_4$ アルキル基、

(3)アリアル基であって、該アリアル基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて

いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N, N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$

$\sim C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて

いてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ（ $C_1 \sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である）；

(xi)  $-(CH_2)_n-OR^{12}$ （ここで、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_5$ アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されて  
いてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$   
および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換  
されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基かである）、ニトロ基、カルバモイル  
10 基、 $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基； $N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ ア  
ルキル）カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐してい  
てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基であ  
る）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{30}R^{31}$ （ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル  
基かである）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20  $N-(C_1\sim C_4\text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N$ ， $N$ -ジ（ $C_1\sim C_4$ アルキル）カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
子で置換されていてもよい $C_1$ ～ $C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、



からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xii)  $-(CH_2)_n-S-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

5 (2) 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基;  $N$ ,  $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基かである)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

- 5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

- 10 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

- 20 シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、

ニトロ基、

- 25 カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xiii) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO - R<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、

10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

20 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基; N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCO<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基;  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

ニトロ基、

5

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリアル基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ; ならびに

15

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO_2-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリアル基であって、該アリアル基が

20

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

25

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換

5 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

15  $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

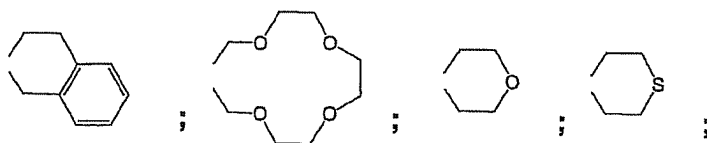
20 分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

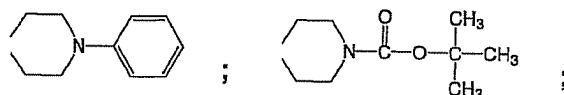
25 ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換

- 5 されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル  
 基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基; $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{ア}$   
 ルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐してい  
 てもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基であ  
 る)で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 $-NR^{30}R^{31}$ (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基かである)、  
 10 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよくかつハロゲン原  
 15 子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、  
 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
 20 る);  
 からなる群より選択される基であるか、あるいは、  
 $R^7$ および $R^8$ は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$ (ここで、 $m$ は2から8の  
 整数である);

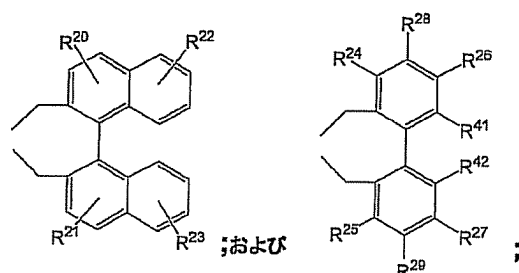
357



5



10



(ここで、 $R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{29}$ 、 $R^{41}$ 、および $R^{42}$ はそれぞれ独立して、

15

水素原子；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_8$ アルキル基；

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル基；

20

分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル基；

ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ のアルキル基で置換されていてもよいアリール基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換

25



されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである) か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール基;

5      ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである) か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

10      ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである) か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、アリール部分を有する、  
15      アラルキル基;

20      ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、ハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_3$ アルコキシ基か、シアノ基か、ハロゲン原子か、ニトロ基か、 $-NR^{30}R^{31}$  (ここで、 $R^{30}$ および $R^{31}$ は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基かである) か、あるいは $C_2 \sim C_8$ アルキレン基で環を構成してなる環状アミノ基か、で置換されていてもよい、ヘテロアリール部分を有する、ヘテロアラルキル基;

( $C_1 \sim C_3$ アルコキシ) カルボニル基;

25      カルバモイル基;

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基; ならびに

N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基(ここで、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基は、互いに同じでも異なってもよい)からなる群より選択される基である)

からなる群より選択される二価の基である、請求項15に記載の方法。

5

17. 前記式(I)で表される化合物のR<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、およびR<sup>3'</sup>のすべてが、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基である、請求項16に記載の方法。

10

18. 前記式(I)で表される化合物のR<sup>1</sup>、R<sup>1'</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、およびR<sup>3'</sup>のすべてがメトキシ基、エトキシ基、またはベンジルオキシ基である、請求項10に記載の方法。

15

19. 前記式(I)で表される化合物のR<sup>4</sup>およびR<sup>4'</sup>が、それぞれ独立して、

水素原子；ならびに

アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>

20

アルキル基、

分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

25

ハロゲン原子、分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup>(ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基かである)、ニトロ基、カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

5           シアノ基、

-NR<sup>30</sup>R<sup>31</sup> (ここで、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>は、それぞれ独立して、水素原子か、またはハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

          ニトロ基、

10           カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

15           ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

          からなる群より選択される基である、請求項16から18のいずれかに記載の方法。

20

20. 前記式(I)で表される化合物のR<sup>4</sup>およびR<sup>4'</sup>が3, 4, 5-トリフルオロフェニル基または3, 5-ビストリフルオロメチルフェニル基である、請求項19に記載の方法。

25

21. 前記式(I)で表される化合物のR<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>がそれぞれ独立して、分岐または環を形成していてもよくかつハロゲン原子で置換されていてもよ

い、 $C_1 \sim C_{30}$ のアルキル基である、請求項16から20のいずれかに記載の方法。

22. 前記式(I)で表される化合物の $R^7$ および $R^8$ がともにn-ブチル基  
5 である、請求項21に記載の方法。

23. 前記無機塩基が無機塩基水溶液の形態で用いられる、請求項15に記載の方法。

10 24. 前記式(IV)で表される化合物1当量に対し、前記無機塩基水溶液中の前記無機塩基が0.5当量以上かつ280当量以下の割合で使用される、請求項23に記載の方法。

15 25. 前記無機塩基水溶液の濃度が10w/w%から70w/w%である、請求項24に記載の方法。

20 26. 前記式(IV)で表される化合物1モルに対し、前記式(I)で表される化合物が、0.0001モル%から5モル%の割合で使用される、請求項24または25に記載の方法。

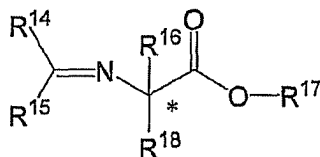
27. 前記媒体と前記無機塩基水溶液との容積比が、7:1から1:5である、請求項24から26のいずれかに記載の方法。

25 28. 前記媒体と前記無機塩基水溶液との容積比が、7:1から1:5である、請求項23に記載の方法。

29. 前記無機塩基水溶液の濃度が10w/w%から70w/w%である、  
請求項28に記載の方法。

30. 前記式(IV)で表される化合物1モルに対し、前記式(I)で表さ  
れる化合物が、0.0001モル%から5モル%の割合で使用される、請求  
項28または29に記載の方法。

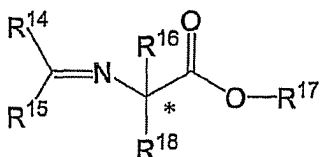
31. 光学活性な $\alpha$ -アミノ酸を製造するための方法であって、  
請求項15から30のいずれかに記載の方法により得られた式(VI)で  
表される化合物：



(VI)

(ここで、 $\text{R}^{14}$ 、 $\text{R}^{15}$ 、 $\text{R}^{16}$ 、 $\text{R}^{17}$ および $\text{R}^{18}$ は上記に定義した基と同様  
である)のイミノ基( $\text{R}^{14}\text{R}^{15}\text{C}=\text{N}-$ )を酸性条件下で加水分解する工  
程；および該酸性加水分解産物のエステル基( $-\text{CO}_2\text{R}^{17}$ )を酸性もしく  
は塩基性条件下で加水分解する工程；を包含する、方法。

32. 光学活性な $\alpha$ -アミノ酸を製造するための方法であって、  
請求項15から30のいずれかに記載の方法により得られた式(VI)で  
表される化合物：



(VI)

(ここで、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ および $R^{18}$ は上記に定義した基と同様である)のエステル基( $-CO_2R^{17}$ )を塩基性条件下で加水分解する工程；および該塩基性加水分解産物のイミノ基( $R^{14}R^{15}C=N-$ )を酸性条件下で加水分解する工程；を包含する、方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/306791

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D223/18(2006.01), C07D487/10(2006.01), C07D498/10(2006.01), C07D513/10(2006.01), C07C227/04(2006.01), C07C227/32(2006.01), C07C229/36(2006.01), C07C249/02(2006.01), C07C251/24(2006.01), B01J31/02(2006.01),  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

B01J31/02, C07B53/00, C07B61/00, C07C227/04, C07C227/32, C07C229/36, C07C249/02, C07C251/24, C07D223/18, C07D487/10, C07D498/10, C07D513/10

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2006  
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2006 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2006

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	JP 2004-359578 A (NIPPON SODA CO.), 24 December, 2004 (24.12.04), Claims; pages 14, 18 (Family: none)	1-5, 15-30 8-14, 31, 32
X Y	OOI, T., A new N-spiro C2-symmetric chiral quaternary ammonium bromide consisting of 4,6-disubstituted biphenyl subunit as an efficient chiral phase-transfer catalyst, Synlett(2003), No.12, pages 1931 to 1933 page 1931, right column; page 1933	1-7, 15-30 8-14, 31, 32
X	KASHIWADA, Y., New hexahydroxybiphenyl derivatives as inhibitors of protein kinase C, Journal of Medicinal Chemistry(1994), Vol.37, No.1, pages 195 to 200; page 196, right column	1-4

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
18 April, 2006 (18.04.06)

Date of mailing of the international search report  
02 May, 2006 (02.05.06)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/306791

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	INSOLE, J.M., Steric effects of methoxy groups in 2,2'-bridged biphenyls.II., Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 2: Physical Organic Chemistry(1972-1999), (1972), No.9, pages 1168 to 1173; page 1972, left column; page 1973, left column	1,4,8,11
X	Chemical Abstract 46:67079, OREF 46:11211e-i, 11212a-i, BEAVEN, G.H., Relation between configuration and conjugation in diphenyl derivatives.I. The enantiomorphism and ultraviolet absorption spectra of some 2,2'bridged compounds, Journal of the Chemical Society(1952), pp.854-68, column 11212, d-e	1,4,8,11
X	Chemical Abstract 52:55790, OREF 52:10014g-i, 10015a-c, FITTS, D.D., Configurational studies in the biphenyl series.IV.Conformation and optical rotation of restricted biphenyls. Configurational correlation of biaryls by optical displacement. The absolute configuration of restricted 1,1'-binaphthyls, Journal of the American Chemical Society(1958), Vol.80, pp.480-6, column 10015, a-c	1,4,8,11
X	Chemical Abstract 53:2119, OREF 53:405c-i, 406a, AHMED, SHAKTI R., Steric effects in 2,2'-bridged biphenyls with a heterocyclic bridging ring.I. Optically active dihydrodibenzazepines, Journal of the Chemical Society(1958), pp.3043-7, column 405, d, h-i	1,4,8,11
X	Chemical Abstract 55:38083, OREF 55:7430c-f, AHMED, SHAKTI R., Steric effects in 2,2'-bridged biphenyls with a heterocyclic bridging ring.III. Ultraviolet absorption spectra of some dihydrodibenzazepinium compounds, Journal of the Chemical Society(1960), pp.4165-9, Column 7430, d-e	1,4
Y	LYGO, B., Identification of a highly effective asymmetric phase-transfer catalyst derived from a-methylnaphthylamine, Tetrahedron Letters(2003), Vol.44, No.30, pages 5629 to 5632; page 5630, right column	1-32
Y	JP 2002-326992 A (NAGASE SANGYO KK), 15 November, 2002 (15.11.02), Page 7 (Family: none)	1-32



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/306791

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	SHI, M., Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-6,6'-dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-1,1'-binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts, Journal of Chemical Research, Synopses(1995), No.2, pages 46 to 47, page 46	1-32
Y	OOI, T., Molecular Design of a C2-Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of $\alpha$ -Amino Acids.J.Am.Chem.Soc.(1999), Vol.121, No.27, pages 6519 to 6520; page 6519, left column	1-32
P,X	HAN, ZHENFU, Convenient preparation of highly active phase-transfer catalyst for catalytic asymmetric synthesis of $\alpha$ -alkyl- and $\alpha$ , $\alpha$ -dialkyl- $\alpha$ -amino acids: application to the short asymmetric synthesis of BIRT-377 Tetrahedron Letters(2005), Vol.46, No.49, pages 8555 to 8558	1-32

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/306791

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
(International Patent Classification (IPC))

C07B53/00(2006.01), C07B61/00(2006.01)

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national  
classification and IPC)

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/306791

The subject matters of claims 1-32 are compounds represented by the formula (I), a method of reaction using the compounds as a catalyst, etc. However, compounds having the basic skeleton in the formula (I) are known as apparent from the fact that they are described in document (JP 2004-359578 A (NIPPON SODA CO), December 24, 2004), etc. The compounds claimed are hence not considered to have a novel basic skeleton common among their chemical structures. In view of this, one invention cannot be clearly grasped from the claims, in which such compounds are described.

On the other hand, a search through prior-art documents was made, while referring to the contents of the description. However, in part of the search, many compounds falling under the category of the compounds claimed were already found.

Furthermore, the compounds which are supported by the description in the meaning of Article 6 of the PCT and are disclosed in the meaning of Article 5 of the PCT are limited to an extremely small part of the compounds represented by the formula (I) given in claims 1-32.

Therefore, an international search was made for the compounds specifically described in the description within the range of a reasonable burden.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))			
Int.Cl. C07D223/18 (2006.01), C07D487/10 (2006.01), C07D498/10 (2006.01), C07D513/10 (2006.01), C07C227/04 (2006.01), C07C227/32 (2006.01), C07C229/36 (2006.01), C07C249/02 (2006.01), C07C251/24 (2006.01), B01J31/02 (2006.01), C07B53/00 (2006.01), C07B61/00 (2006.01)			
B. 調査を行った分野			
調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (I P C))			
Int.Cl. B01J 31/02, C07B 53/00, C07B 61/00, C07C 227/04, C07C 227/32, C07C 229/36, C07C 249/02, C07C 251/24, C07D 223/18, C07D 487/10, C07D 498/10, C07D 513/10			
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの			
日本国実用新案公報 1922-1996年 日本国公開実用新案公報 1971-2006年 日本国実用新案登録公報 1996-2006年 日本国登録実用新案公報 1994-2006年			
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)			
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)			
C. 関連すると認められる文献			
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号	
X	JP 2004-359578 A (NIPPON SODA CO) 2004.12.24, (ファミリーなし)	1-7, 15-30	
Y	特許請求の範囲, 第14頁, 第18頁等参照	8-14, 31, 32	
X	OOI, T., A new N-spiro C2-symmetric chiral quaternary ammonium bromide	1-7, 15-30	
Y	consisting of 4,6-disubstituted biphenyl subunit as an efficient chiral phase-transfer catalyst, Synlett (2003), No.12, pp.1931-1933 第1931頁右欄, 第1933頁等参照	8-14, 31, 32	
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。			
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献			
国際調査を完了した日 18.04.2006		国際調査報告の発送日 02.05.2006	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (I S A / J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官 (権限のある職員) 安藤 倫世 電話番号 03-3581-1101 内線 3491	4 P 9837

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	KASHIWADA, Y., New hexahydroxybiphenyl derivatives as inhibitors of protein kinase C, Journal of Medicinal Chemistry (1994), Vol. 37, No. 1, pp. 195-200 第 196 頁右欄等参照	1-4
X	INSOLE, J. M., Steric effects of methoxy groups in 2,2'-bridged biphenyls. II., Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 2: Physical Organic Chemistry (1972-1999) (1972), No. 9, pp. 1168-1173 第 1972 頁左欄、第 1973 頁左欄等参照	1, 4, 8, 11
X	Chemical Abstract 46:67079, OREF 46:11211e-i, 11212a-i, BEAVEN, G. H., Relation between configuration and conjugation in diphenyl derivatives. I. The enantiomorphism and ultraviolet absorption spectra of some 2,2' bridged compounds, Journal of the Chemical Society (1952), pp. 854-68 第 11212 欄 d-e 等参照	1, 4, 8, 11
X	Chemical Abstract 52:55790, OREF 52:10014g-i, 10015a-c, FITTS, D. D., Configurational studies in the biphenyl series. IV. Conformation and optical rotation of restricted biphenyls. Configurational correlation of biaryls by optical displacement. The absolute configuration of restricted 1,1'-binaphthyls, Journal of the American Chemical Society (1958), VOL. 80, pp. 480-6 第 10015 欄 a-c 等参照	1, 4, 8, 11
X	Chemical Abstract 53:2119, OREF 53:405c-i, 406a, AHMED, SHAKTI R., Steric effects in 2,2'-bridged biphenyls with a heterocyclic bridging ring. I. Optically active dihydrodibenzazepines, Journal of the Chemical Society (1958), pp. 3043-7 第 405 欄 d、h-i 等参照	1, 4, 8, 11
X	Chemical Abstract 55:38083, OREF 55:7430c-f, AHMED, SHAKTI R., Steric effects in 2,2'-bridged biphenyls with a heterocyclic bridging ring. III. Ultraviolet absorption spectra of some dihydrodibenzazepinium compounds, Journal of the Chemical Society (1960), pp. 4165-9 第 7430 欄 d-e 等参照	1, 4
Y	LYGO, B., Identification of a highly effective asymmetric phase-transfer catalyst derived from $\alpha$ -methylnaphthylamine, Tetrahedron Letters (2003), VOL. 44, No. 30, pp. 5629-5632 第 5630 頁右欄等参照	1-32

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	JP 2002-326992 A (NAGASE SANGYO KK) 2002. 11. 15, (ファミリーなし) 第 7 頁等参照	1-32
Y	SHI, M., Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2, 2' -bis(bromomethyl)-6, 6' - dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2, 2' -bis(bromomethyl)-1, 1' -binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts, Journal of Chemical Research, Synopses (1995), No. 2, pp. 46-47 第 46 頁等参照	1-32
Y	OOI, T., Molecular Design of a C2-Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of $\alpha$ -Amino Acids. J. Am. Chem. Soc. (1999), VOL. 121, NO. 27, pp. 6519-6520 第 6519 頁左欄等参照	1-32
P, X	HAN, ZHENFU, Convenient preparation of highly active phase-transfer catalyst for catalytic asymmetric synthesis of $\alpha$ -alkyl- and $\alpha, \alpha$ - dialkyl- $\alpha$ -amino acids: application to the short asymmetric synthesis of BIRT-377 Tetrahedron Letters (2005), VOL. 46, No. 49, pp. 8555-8558	1-32

請求の範囲 1-32 に係る発明は、式 (I) で表される化合物又はそれを触媒とする反応方法等の発明であるが、式 (I) における基本骨格を有する化合物が、文献(JP 2004-359578 A (NIPPON SODA CO) 2004.12.24)等により公知であるから、本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

一方、本願明細書の記載内容に照らし、先行技術文献調査を試みたが、その調査の一部において、既に、本願発明化合物に該当する化合物が多数発見されている。

また、特許協力条約第 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第 5 条の意味において明細書に開示されているものは、請求の範囲 1-32 の発明における式 (I) で表される化合物の中の、ごく僅かな部分に過ぎない。

したがって、この国際調査では、明細書に具体的に記載された化合物に基づき、合理的な負担の範囲内で調査を行った。